

Europäisches Patentamt  
European Patent Office  
Office européen des brevets



(11) **EP 1 544 193 A1**

(12) **EUROPEAN PATENT APPLICATION**  
published in accordance with Art. 158(3) EPC

(43) Date of publication:  
**22.06.2005 Bulletin 2005/25**

(21) Application number: **03792848.8**

(22) Date of filing: **26.08.2003**

(51) Int Cl.7: **C07C 311/46**, C07C 311/48,  
C07C 311/49, C07C 311/50,  
C07C 317/28, C07C 323/49,  
C07D 213/75, C07D 213/42,  
C07D 279/12, A01N 41/06,  
A01N 43/40, A01N 47/02

(86) International application number:  
**PCT/JP2003/010774**

(87) International publication number:  
**WO 2004/018415 (04.03.2004 Gazette 2004/10)**

(84) Designated Contracting States:  
**AT BE BG CH CY CZ DE DK EE ES FI FR GB GR  
HU IE IT LI LU MC NL PT RO SE SI SK TR**  
Designated Extension States:  
**AL LT LV MK**

(30) Priority: **26.08.2002 JP 2002245264**

(71) Applicant: **Nihon Nohyaku Co., Ltd.**  
**Tokyo 103-8236 (JP)**

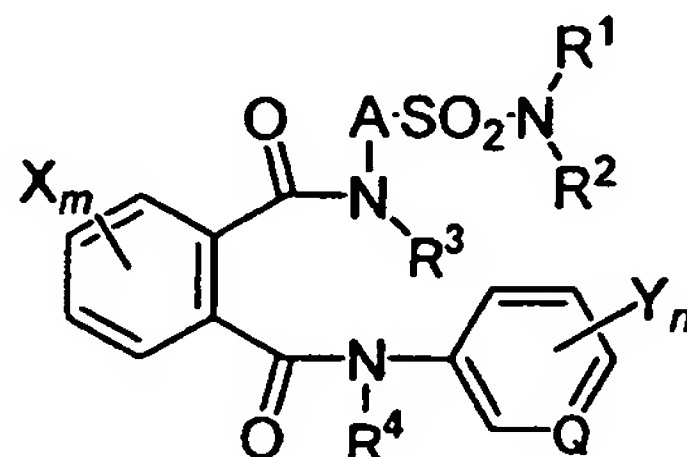
(72) Inventors:  
• **YAMAGUCHI, Minoru**  
**NIHON NOHYAKU CO., LTD. RESEARCH**  
**Kawachinagano-shi, Osaka 586-0094 (JP)**  
• **NAKAO, Hayami**  
**NIHON NOHYAKU CO., LTD. RESEARCH CNT**  
**Kawachinagano-shi, Osaka 586-0094 (JP)**

• **GOTO, Makoto**  
**c/o NIHON NOHYAKU CO., LTD. RESEARCH**  
**Kawachinagano-shi, Osaka 586-0094 (JP)**  
• **MORIMOTO, Masayuki**  
**c/o NIHON NOHYAKU CO., LTD.**  
**Kawachinagano-shi, Osaka 586-0094 (JP)**  
• **FUJIOKA, Shinsuke**  
**c/o NIHON NOHYAKU CO., LTD.**  
**Kawachinagano-shi, Osaka 586-0094 (JP)**  
• **TOHNISHI, Masanori**  
**c/o NIHON NOHYAKU CO., LTD.**  
**Kawachinagano-shi, Osaka 586-0094 (JP)**

(74) Representative: **Grünecker, Kinkeldey,**  
**Stockmair & Schwanhäusser Anwaltssozietät**  
**Maximilianstrasse 58**  
**80538 München (DE)**

(54) **SULFONAMIDE DERIVATIVES, INSECTICIDES FOR AGRICULTURAL AND HORTICULTURAL USE, AND USAGE THEREOF**

(57) Sulfonamide derivatives represented by general formula (I) or salts thereof; insecticides for agricultural and horticultural use containing the same as the active ingredient; and usage thereof:



(I)

[wherein A is optionally substituted (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkylene, (C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>)alkenylene or the like; R<sup>1</sup> is H, optionally substituted (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkyl, (C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>)alkenyl, (C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>)cycloalkyl or the like; R<sup>2</sup>, R<sup>3</sup> and R<sup>4</sup> are each H, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkyl, (C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>)alkenyl or the like, or R<sup>2</sup> and A or R<sup>2</sup> and R<sup>1</sup> may form a 3- to 8-membered ring which may be interrupted by one to three atoms

EP 1 544 193 A1

## EP 1 544 193 A1

selected from among O, S and N; Q is C or N; X and Y are each halogen, CN, NO<sub>2</sub>, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkyl, (C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>)alkenyl or the like; m is 0 to 2; n is 0 to 3; and two adjacent Xs or Ys on the aromatic ring may be united to form a fused ring]. The compounds exhibit excellent insecticidal activity against insect pests resistant to existing pesticides even when applied in dosages lower than those of similar pesticides.

## Description

## TECHNICAL FIELD

5 [0001] The present invention relates to sulfonamide derivatives or salts thereof, agricultural and horticultural insecticides containing any of said compounds as an active ingredient, and their usage.

## BACKGROUND ART

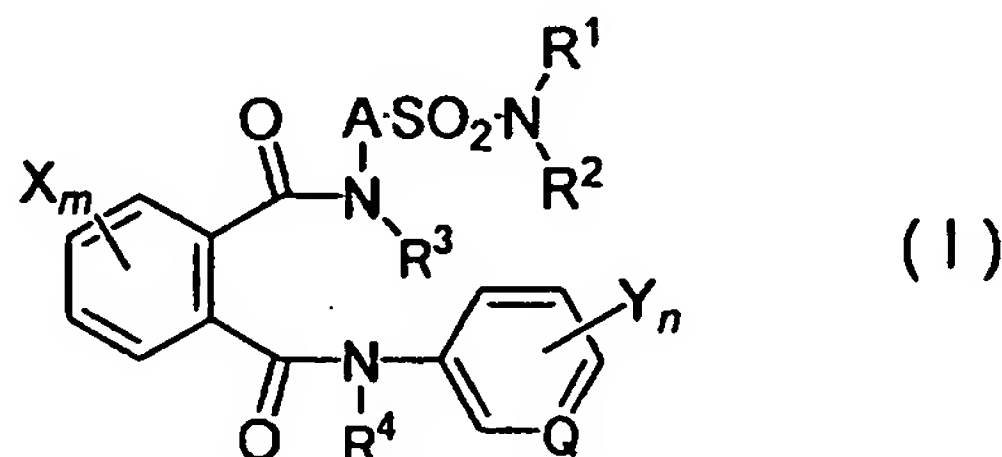
10 [0002] Compounds analogous to the sulfonamide derivatives of the present invention have been known to be useful as agricultural and horticultural insecticides (see, for example, JP-A-11-240857 or JP-A-2001-131141). These references, however, do not describe working examples, physical properties and the like with respect to the compounds represented by general formula (I) of the present invention.

15 [0003] The production of agricultural and horticultural crops and the like is still badly damaged by insect pests and the like, and the development of a novel agricultural and horticultural insecticide is desired because of, for example, the appearance of insect pests resistant to existing chemicals. In addition, because of the increased population of aged farmers, and the like, various labor-saving application methods are desired and the development of an agricultural and horticultural insecticide having properties suitable for the application methods is desired.

## 20 DISCLOSURE OF THE INVENTION

[0004] The present inventors earnestly investigated in order to develop a novel agricultural and horticultural insecticide, and consequently found that the sulfonamide derivatives represented by general formula (I) or salts thereof of the present invention are novel compounds not known in any literature and are excellent agricultural and horticultural insecticides which are effective at a lower dosage as compared with the analogous compounds disclosed in the above prior art references, whereby the present invention has been accomplished.

25 [0005] That is, the present invention relates to sulfonamide derivatives represented by general formula (I), or salts thereof:



45 wherein A is a (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkylene group; a substituted (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkylene group having one or more substituents which may be the same or different and are selected from halogen atoms, cyano group, nitro group, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkoxy groups, halo (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkoxy groups, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkylthio groups, halo(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkylthio groups, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkylsulfinyl groups, halo (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkylsulfinyl groups, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkylsulfonyl groups, halo(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkylsulfonyl groups, mono(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkylamino groups and di(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkylamino groups whose (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkyl groups may be the same or different; a (C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>)alkenylene group; a substituted (C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>)alkenylene group having one or more substituents which may be the same or different and are selected from halogen atoms, cyano group, nitro group, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkoxy groups, halo(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkoxy groups, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkylthio groups, halo(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkylthio groups, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkylsulfinyl groups, halo(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkylsulfinyl groups, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkylsulfonyl groups, halo(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkylsulfonyl groups, mono(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkylamino groups and di(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkylamino groups whose (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkyl groups may be the same or different; a (C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>)alkynylene group; or a substituted (C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>)alkynylene group having one or more substituents which may be the same or different and are selected from halogen atoms, cyano group, nitro group, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkoxy groups, halo(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkoxy groups, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkylthio groups, halo(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkylthio groups, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkylsulfinyl groups, halo(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkylsulfinyl groups, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkylsulfonyl groups, halo(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkylsulfonyl groups, mono(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkylamino groups and di(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkylamino groups whose (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkyl groups may be the same or different; any saturated carbon atom in the (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkylene group, substituted (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkylene group, (C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>)alkenylene group, substituted (C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>)alkenylene group, (C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>)alkynylene group or substituted (C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>)alkynylene group may be substituted by a (C<sub>2</sub>-C<sub>5</sub>)alkylene group so as to form a (C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>)cycloalkane ring, and any two

[illegible]



groups, mono(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkylamino groups, mono (halo(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkyl)amino groups, di(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkylamino groups whose (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkyl groups may be the same or different, di(halo(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkyl)amino groups whose halo(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkyl groups may be the same or different, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkoxycarbonyl groups and (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkylaminocarbonyl groups; a pyridyl group; or a substituted pyridyl group having one or more substituents which may be the same or different and are selected from halogen atoms, cyano group, nitro group, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkyl groups, halo(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkyl groups, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkoxy groups, halo(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkoxy groups, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkylthio groups, halo(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkylthio groups, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkylsulfinyl groups, halo(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkylsulfinyl groups, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkylsulfonyl groups, halo(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkylsulfonyl groups, mono(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkylamino groups, mono (halo(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkyl)amino groups, di(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkylamino groups whose (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkyl groups may be the same or different, di(halo(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkyl)amino groups whose halo(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkyl groups may be the same or different, and (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkoxycarbonyl groups;

each of R<sup>2</sup>, R<sup>3</sup> and R<sup>4</sup>, which may be the same or different, is a hydrogen atom, a (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkyl group, a (C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>)alkenyl group, a (C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>)alkynyl group, a (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)alkoxy(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)alkyl group or a (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)alkylthio(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)alkyl group, R<sup>2</sup> being able to bind to A or R<sup>1</sup> to form a 3- to 8-membered ring which may contain one to three atoms that may be the same or different and are selected from oxygen atom, sulfur atom and nitrogen atom, and which ring may have one or more substituents that may be the same or different and are selected from halogen atoms, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkyl groups and (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkoxy groups, and R<sup>2</sup> being able to be taken together with R<sup>1</sup> to represent =C(T<sup>3</sup>)T<sup>4</sup> (wherein each of T<sup>3</sup> and T<sup>4</sup>, which may be the same or different, is a hydrogen atom, a (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkyl group, a halo(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkyl group, a (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkoxy group, a halo(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkoxy group, an amino group, a mono(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkylamino group, a di(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkylamino group whose (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkyl groups may be the same or different, a mono (halo(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkyl)amino group, a di(halo(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkyl)amino group whose halo(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkyl groups may be the same or different, a phenyl group or a substituted phenyl group having one or more substituents which may be the same or different and are selected from halogen atoms, cyano group, nitro group, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkyl groups, halo(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkyl groups, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkoxy groups, halo(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkoxy groups, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkylthio groups, halo(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkylthio groups, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkylsulfinyl groups, halo(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkylsulfinyl groups, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkylsulfonyl groups, halo(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkylsulfonyl groups, mono(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkylamino groups, mono (halo(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkyl) amino groups, di(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkylamino groups whose (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkyl groups may be the same or different, di(halo(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkyl)amino groups whose halo(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkyl groups may be the same or different, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkoxycarbonyl groups and (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkylaminocarbonyl groups);

Q is a carbon atom or a nitrogen atom;

each of Xs, which may be the same or different, is a halogen atom, a cyano group, a nitro group, an amino group, a (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkyl group, a halo(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkyl group, a (C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>)alkenyl group, a halo(C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>)alkenyl group, a (C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>)alkynyl group, a halo(C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>)alkynyl group, a (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkoxy group, a halo(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkoxy group, a (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkylcarbonyloxy group, a halo(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkylcarbonyloxy group, a (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkylthio group, a halo(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkylthio group, a (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkylsulfinyl group, a halo(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkylsulfinyl group, a (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkylsulfonyl group, a halo(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkylsulfonyl group, a (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkylsulfonyloxy group, a halo(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkylsulfonyloxy group, a mono(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkylamino group, a mono(halo(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkyl)amino group, a di(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkylamino group whose (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkyl groups may be the same or different, a di(halo(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkyl)amino group whose halo(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkyl groups may be the same or different, a (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkylcarbonylamino group, a halo(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkylcarbonylamino group, a (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkylsulfonylamino group or a halo(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkylsulfonylamino group,

further, two adjacent Xs on the aromatic ring being able to be taken together to represent a fused ring that may have one or more substituents which may be the same or different and are selected from halogen atoms, nitro group, cyano group, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkyl groups, halo(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkyl groups, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkoxy groups, halo(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkoxy groups, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkylthio groups, halo(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkylthio groups, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkylsulfinyl groups, halo(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkylsulfinyl groups, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkylsulfonyl groups, halo(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkylsulfonyl groups, mono(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkylamino groups, mono (halo(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkyl)amino groups, di(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkylamino groups whose (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkyl groups may be the same or different, and di(halo(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkyl)amino groups whose halo(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkyl groups may be the same or different, m is an integer of 0 to 2;

each of Ys, which may be the same or different, is a halogen atom; a cyano group; a nitro group; a hydroxyl group; a formyl group; a (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkyl group; a hydroxy(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkyl group; a (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkoxy(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkyl group; a halo(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkoxy(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkyl group; a halo(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkyl group; a hydroxyhalo(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkyl group; a (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkoxyhalo(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkyl group; a halo(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkoxyhalo(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkyl group; a (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkoxy group; a halo(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkoxy group; a halo(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkoxyhalo(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkoxy group; a (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkylthio group; a halo(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkylthio group; a (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkylsulfinyl group; a halo(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkylsulfinyl group; a (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkylsulfonyl group; a halo(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkylsulfonyl group; a halo(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkoxyhalo(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkylthio group; a halo(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkoxyhalo(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkylsulfinyl group; a halo(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkoxyhalo(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkylsulfonyl group; a phenoxy group; a substituted phenoxy group having one or more substituents which may be the same or different and are selected from halogen atoms, cyano group, nitro group, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkyl groups, halo(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkyl groups, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkoxy groups, halo(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkoxy groups, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkylthio groups, halo(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkylthio groups, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkylsulfinyl groups, halo(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkylsulfinyl groups, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkylsulfonyl groups and halo(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkylsulfonyl groups; a phenylthio group; a substituted phenylthio group having one or more substituents which may be the same or different and are selected from halogen atoms, cyano group, nitro group, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkyl groups, halo(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)

alkyl groups, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkoxy groups, halo(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkoxy groups, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkylthio groups, halo(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkylthio groups, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkylsulfinyl groups, halo(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkylsulfinyl groups, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkylsulfonyl groups and halo(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkylsulfonyl groups; a pyridyloxy group; or a substituted pyridyloxy group having one or more substituents which may be the same or different and are selected from halogen atoms, cyano group, nitro group, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkyl groups, halo(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkyl groups, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkoxy groups, halo(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkoxy groups, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkylthio groups, halo(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkylthio groups, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkylsulfinyl groups, halo(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkylsulfinyl groups, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkylsulfonyl groups and halo(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkylsulfonyl groups,

further, two adjacent Ys on the aromatic ring being able to be taken together to represent a fused ring that may have one or more substituents which may be the same or different and are selected from halogen atoms, nitro group, cyano group, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkyl groups, halo(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkyl groups, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkoxy groups, halo(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkoxy groups, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkylthio groups, halo(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkylthio groups, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkylsulfinyl groups, halo(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkylsulfinyl groups, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkylsulfonyl groups, halo(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkylsulfonyl groups, mono(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkylamino groups, mono(halo(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkyl)amino groups, di(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkylamino groups whose (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkyl groups may be the same or different, and di(halo(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkyl)amino groups whose halo(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkyl groups may be the same or different, and n is an integer of 0 to 3; an agricultural and horticultural insecticide containing said compound as an active ingredient, and a method of using the same.

#### MODE FOR CARRYING OUT THE INVENTION

**[0007]** In the definition of general formula (I) for the sulfonamide derivative of the present invention, the term "halogen atom" means a chlorine atom, a bromine atom, an iodine atom or a fluorine atom. The term "(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkyl" means a linear or branched alkyl group of 1 to 6 carbon atoms, such as methyl, ethyl, n-propyl, i-propyl, n-butyl, i-butyl, s-butyl, t-butyl, n-pentyl, n-hexyl or the like. The term "halo(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkyl" means a substituted linear or branched alkyl group of 1 to 6 carbon atoms having as the substituent(s) one or more halogen atoms which may be the same or different. The term "(C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>)cycloalkyl" means a cyclic alkyl group of 3 to 6 carbon atoms, such as cyclopropyl, cyclobutyl, cyclopentyl, cyclohexyl or the like. The term "(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkylene" means a linear or branched alkylene group of 1 to 6 carbon atoms, such as methylene, ethylene, propylene, trimethylene, dimethylmethylene, tetramethylene, isobutylene, dimethylethylene or the like. The term "(C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>)alkenylene" means a linear or branched alkenylene group of 2 to 6 carbon atoms. The term "(C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>)alkynylene" means a linear or branched alkynylene group of 2 to 6 carbon atoms.

**[0008]** The "fused ring" includes, for example, naphthalene ring, tetrahydronaphthalene ring, indene ring, indane ring, quinoline ring, quinazoline ring, chroman ring, isochroman ring, indole ring, indoline ring, benzodioxane ring, benzodioxole ring, benzofuran ring, dihydrobenzofuran ring, benzothiophene ring, dihydrobenzothiophene ring, benzoxazole ring, benzothiazole ring, benzimidazole ring and indazole ring.

**[0009]** The salts of the sulfonamide derivative represented by general formula (I) of the present invention include, for example, inorganic acid salts such as hydrochloride, sulfate, nitrate, phosphate and the like; organic acid salts such as acetate, fumarate, maleate, oxalate, methanesulfonate, benzenesulfonate, p-toluenesulfonate and the like; and salts with a sodium ion, potassium ion, calcium ion or the like.

**[0010]** The sulfonamide derivative of general formula (I) of the present invention contains one or more asymmetric carbon atoms or asymmetric centers in its structural formula in some cases and has two or more optical isomers and diastereomers in some cases. The present invention also includes all of the individual optical isomers and mixtures consisting of these isomers in any ratio. The sulfonamide derivative of general formula (I) of the present invention has two or more geometrical isomers due to one or more carbon-carbon double bonds or carbon-nitrogen double bonds in its structural formula in some cases. The present invention also includes all of the individual geometrical isomers and mixtures consisting of these isomers in any ratio.

**[0011]** In the sulfonamide derivative of general formula (I) of the present invention, A is particularly preferably a (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkylene group; R<sup>1</sup> is preferably a hydrogen atom, a (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkyl group, a substituted (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkyl group, a (C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>)alkenyl group, a (C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>)alkynyl group, a phenyl group or a substituted phenyl group, and is particularly preferably a (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkyl group, a (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkylthio(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkyl group, a (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkylsulfinyl(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkyl group or a (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkylsulfonyl(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkyl group; each of R<sup>2</sup>, R<sup>3</sup> and R<sup>4</sup> is preferably a hydrogen atom or a (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkyl group; Q is preferably a carbon atom or a nitrogen atom, particularly preferably a carbon atom; X is preferably a halogen atom, a nitro group, a (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkyl group, a halo(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkyl group, a halo(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkoxy group, a (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkylcarbonyloxy group, a (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkylsulfonyloxy group or a halo(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkylsulfonyloxy group, and is particularly preferably a halogen atom; m is preferably 1 or 2, particularly preferably 1; Y is preferably a halogen atom, a (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkyl group, a halo(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkoxy(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkyl group, a halo(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkyl group, a hydroxyhalo(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkyl group, a (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkoxyhalo(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkyl group, a halo(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkoxyhalo(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkyl group, a (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkoxy group or a halo(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkoxy group, and is particularly preferably a (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkyl group or a halo(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkyl group; and n is preferably an integer of 1 to 3, particularly preferably 2.

**[0012]** The sulfonamide derivative of general formula (I) of the present invention can be produced, for example, by any of the production processes schematically shown below, but these processes are not intended in any way to limit

the scope of the present invention.

## Production processes

5

10

15

20

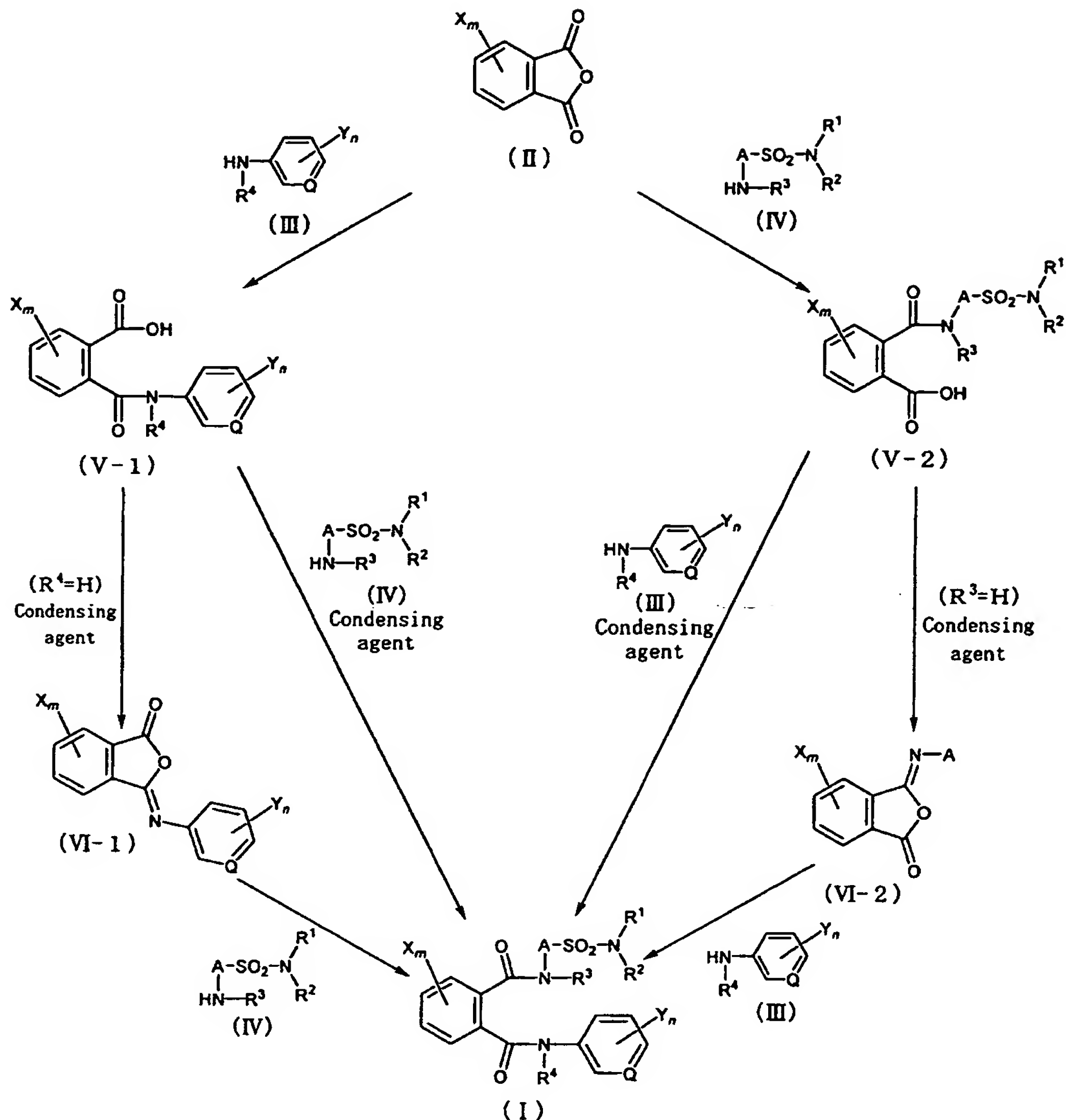
25

30

35

40

45



wherein A,  $R^1$  to  $R^4$ , X, Y, n, m and Q are as defined above.

**[0013]** The production can be carried out by the above reactions according to the process disclosed in J. Med. Chem., 10, 982 (1967), JP-A-11-240857, JP-A-2001-131141 or the like. That is, a phthalic anhydride of general formula (II) is allowed to react with an amine of general formula (III) in the presence of an inert solvent and in the presence or absence of a base or an acid catalyst to obtain a phthalamide of general formula (V-1). When  $R^4$  is a hydrogen atom in the phthalamide (V-1), the phthalamide (V-1) is converted to an isoimide derivative of general formula (VI-1) by condensation in the presence of a condensing agent and an inert solvent and in the presence or absence of a base after or without isolating the phthalamide (V-1), and the isoimide derivative (VI-1) is allowed to react with a sulfamoylamine of general formula (IV) in the presence of an inert solvent and in the presence or absence of a base or an acid catalyst after or without isolating the isoimide derivative (VI-1), whereby the sulfonamide derivative of general formula (I) can be produced. When  $R^4$  is a substituent other than a hydrogen atom in the phthalamide (V-1), the sulfonamide derivative of general formula (I) can be produced by condensing the phthalamide (V-1) with a sulfamoylamine of general formula



(IV) in the presence of a condensing agent and an inert solvent and in the presence or absence of a base after or without isolating the phthalamide (V-1).

[0014] In addition, a phthalic anhydride of general formula (II) is allowed to react with a sulfamoylamine of general formula (IV) in the presence of an inert solvent and in the presence or absence of a base or an acid catalyst to obtain a phthalamide of general formula (V-2). When R<sup>3</sup> is a hydrogen atom in the phthalamide (V-2), the phthalamide (V-2) is converted to an isoimide derivative of general formula (VI-2) by condensation in the presence of a condensing agent and an inert solvent and in the presence or absence of a base after or without isolating the phthalamide (V-2), and the isoimide derivative (VI-2) is allowed to react with an amine of general formula (III) in the presence of an inert solvent and in the presence or absence of a base or an acid catalyst after or without isolating the isoimide derivative (VI-2), whereby the sulfonamide derivative of general formula (I) can be produced. When R<sup>3</sup> is a substituent other than a hydrogen atom in the phthalamide (V-2), the sulfonamide derivative of general formula (I) can be produced by condensing the phthalamide (V-2) with an amine of general formula (III) in the presence of a condensing agent and an inert solvent and in the presence or absence of a base after or without isolating the phthalamide (V-2).

#### 1. General formula (II) → general formula (V-1) or general formula (V-2)

[0015] The acid usable in this reaction includes, for example, organic acids such as acetic acid, trifluoroacetic acid, etc.; and inorganic acids such as hydrochloric acid, sulfuric acid, etc. As to the amount of the acid used, the acid may be used in an amount properly chosen in the range of a catalytic amount to excess moles per mole of the phthalic anhydride of general formula (II). The base includes, for example, organic bases such as triethylamine, pyridine, etc.; and inorganic bases such as potassium carbonate, sodium hydrogencarbonate, sodium carbonate, sodium hydroxide, etc. As to the amount of the base used, the base may be used in an amount properly chosen in the range of a catalytic amount to excess moles per mole of the phthalic anhydride of general formula (II).

[0016] As the inert solvent used in the reaction, any inert solvent may be used so long as it does not markedly inhibit the progress of the reaction. There can be exemplified inert solvents including, for example, aromatic hydrocarbons such as benzene, toluene, xylene, etc.; halogenated hydrocarbons such as methylene chloride, chloroform, carbon tetrachloride, etc.; halogenated aromatic hydrocarbons such as chlorobenzene, dichlorobenzene, etc.; acyclic or cyclic ethers such as diethyl ether, dioxane, tetrahydrofuran, etc.; esters such as ethyl acetate, etc.; amides such as dimethylformamide, dimethylacetamide, etc.; acids such as acetic acid, etc.; dimethyl sulfoxide; and 1,3-dimethyl-2-imidazolidinone. These inert solvents may be used singly or as a mixture of two or more thereof.

[0017] Since the reaction is an equimolar reaction, it is sufficient that the reactants are used in equimolar amounts, though either of them may be used in excess.

[0018] As to the reaction temperature, the reaction can be carried out at room temperature to the boiling point of the inert solvent used. Although the reaction time is varied depending on the scale of reaction and the reaction temperature, the reaction may be carried out for a period ranging from several minutes to 48 hours.

[0019] After completion of the reaction, the desired compound may be used in the subsequent reaction either after isolation from the reaction system containing the desired compound by a conventional method, or without isolation.

[0020] The phthalic anhydride of general formula (II) can be produced by the process described in J. Org. Chem., 52, 129 (1987), J. Am. Chem. Soc., 51, 1865 (1929), J. Am. Chem. Soc., 63, 1542 (1941) or the like.

#### 2. General formula (V-1) or general formula (V-2) → general formula (I)

[0021] As the inert solvent used in this reaction, any inert solvent may be used so long as it does not markedly inhibit the progress of the reaction. There can be exemplified inert solvents including, for example, halogenated hydrocarbons such as methylene chloride, chloroform, carbon tetrachloride, etc.; acyclic or cyclic ethers such as diethyl ether, dioxane, tetrahydrofuran, etc.; and nitriles such as acetonitrile, etc. These inert solvents may be used singly or as a mixture of two or more thereof.

[0022] As the condensing agent used in the reaction, any condensing agent may be used so long as it is used in conventional amide production. The condensing agent includes, for example, trifluoroacetic anhydride, chlorocarbonates, Mukaiyama reagent (2-chloro-N-methylpyridinium iodide), DCC (1,3-dicyclohexylcarbodiimide), CDI (carbonyl diimidazole) and DEPC (diethyl cyanophosphonate). As to the amount of the condensing agent used, the condensing agent may be used in an amount properly chosen in the range of 1 mole to excess moles per mole of the phthalamide of general formula (V-1) or (V-2).

[0023] The base usable in the reaction includes, for example, organic bases such as triethylamine, pyridine, etc.; and inorganic bases such as potassium carbonate, etc. As to the amount of the base used, the base may be used in an amount properly chosen in the range of 1 mole to excess moles per mole of the phthalamide of general formula (V-1) or (V-2).

[0024] As to the reaction temperature, the reaction can be carried out at 0°C to the boiling point of the inert solvent

used. Although the reaction time is varied depending on the scale of reaction and the reaction temperature, the reaction may be carried out for a period ranging from several minutes to 48 hours.

[0025] After completion of the reaction, the desired compound is isolated from the reaction system containing the desired compound by a conventional method, and if necessary, purified by recrystallization, column chromatography, etc., whereby the desired compound can be produced.

3. General formula (V-1)  $\rightarrow$  general formula (VI-1), or general formula (V-2)  $\rightarrow$  general formula (VI-2)

[0026] In the case of this reaction, the desired compound can be produced according to, for example, the process described in J. Med. Chem., 10, 982 (1967).

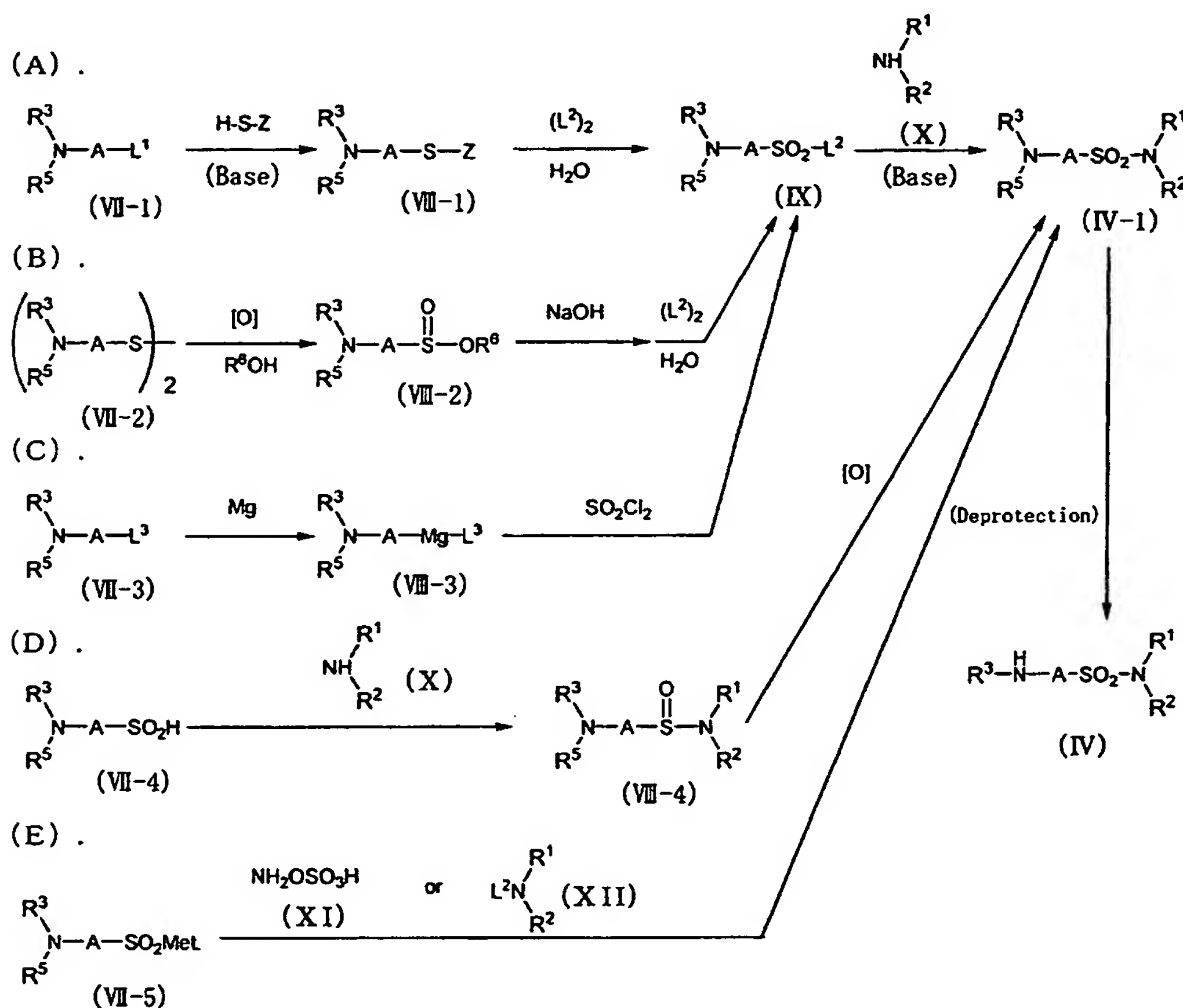
[0027] After completion of the reaction, the desired compound may be used in the subsequent reaction either after isolation from the reaction system containing the desired compound by a conventional method, or without isolation.

4. General formula (VI-1) or general formula (VI-2)  $\rightarrow$  general formula (I)

[0028] In the case of this reaction, the desired compound can be produced in the same manner as in the item 1.

[0029] After completion of the reaction, the desired compound is isolated from the reaction system containing the desired compound by a conventional method, and if necessary, purified by recrystallization, column chromatography, etc., whereby the desired compound can be produced.

[0030] The sulfamoylamine (IV) as starting material can be produced according to, for example, any of the processes known in literature and schematically shown below.



wherein R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup>, R<sup>3</sup> and A are as defined above, R<sup>5</sup> is a protecting group such as a benzyloxycarbonyl group, t-butoxycarbonyl group or alkylsilyl group, R<sup>6</sup> is a (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkyl group, each of L<sup>1</sup>, L<sup>2</sup> and L<sup>3</sup> is a leaving group such as a halogen atom, Met is a metal atom such as sodium or potassium, and Z is a hydrogen atom, a (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkyl group or



a benzyl group.

(A) General formula (VII-1) → general formula (IV)

5 **[0031]** An amine derivative of general formula (VII-1) is allowed to react with a thiol to obtain a thioalkylamine derivative (VIII-1), according to the method described in J. Am. Chem. Soc., 58, 1348 (1936), J. Am. Chem. Soc., 60, 1486 (1938) or the like. The thioalkylamine derivative is allowed to react with a halogen after or without isolation of the derivative to obtain a sulfonyl halide derivative of general formula (IX). The sulfonyl halide derivative is allowed to react with an amine of general formula (X) to obtain a sulfonamide derivative of general formula (IV-1), according to the method described in Synthesis, 1970, 545, J. Organic Chem., 21, 667 (1956) or the like. The sulfonamide derivative is subjected to deprotection reaction according to a conventional method, whereby the sulfamoylamine of general formula (IV) can be produced.

(B) General formula (VII-2) → general formula (IV)

15 **[0032]** A disulfide derivative of general formula (VII-2) is converted to a sulfenic acid ester derivative (VIII-2) according to the method described in Synth. Commun., 27, 1321 (1997), Synthesis, 1988, 252 or the like. The sulfenic acid ester derivative is hydrolyzed after or without isolation and the hydrolyzate is allowed to react with a halogen according to the method described in J. Am. Chem. Soc., 45, 1068 (1923) or the like to obtain a sulfonyl halide derivative of general formula (IX). Thereafter, the sulfamoylamine of general formula (IV) can be produced in the same manner as in (A).

(C) General formula (VII-3) → general formula (IV)

25 **[0033]** An amine derivative of general formula (VII-3) is converted to a Grignard reagent (VIII-3) according to the method described in J. Org. Chem., 20, 1159 (1955) or the like, and the Grignard reagent (VIII-3) is allowed to react with sulfonyl chloride to obtain a sulfonyl halide derivative of general formula (IX). Thereafter, the sulfamoylamine of general formula (IV) can be produced in the same manner as in (A).

(D) General formula (VII-4) → general formula (IV)

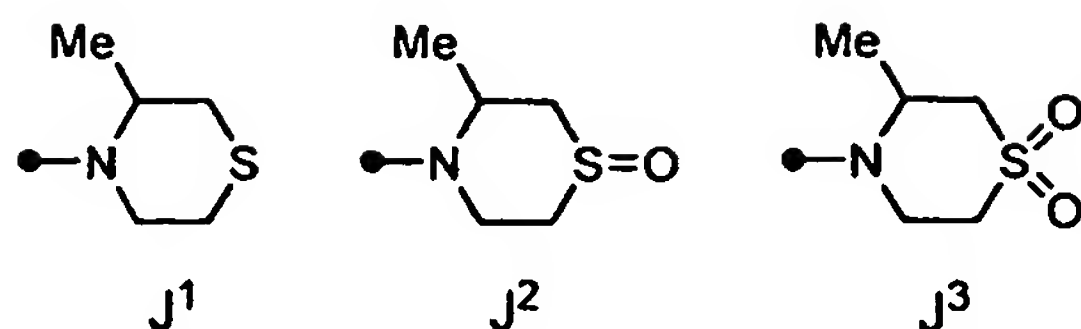
30 **[0034]** A sulfenamide derivative of general formula (VIII-4) is obtained from a sulfenic acid derivative of general formula (VII-4) and an amine derivative of general formula (X) according to the method described in J. Am. Chem. Soc., 57, 2172 (1935), Chem. Lett, 1976, 149 or the like. The sulfenamide derivative is converted to a sulfonamide derivative of general formula (IV-1) according to the method described in J. Org. Chem., 31, 2357 (1966) or the like. Thereafter, the sulfamoylamine of general formula (IV) can be produced by subjecting the sulfonamide derivative to deprotection in the same manner as in (A).

(E) General formula (VII-5) → general formula (IV)

40 **[0035]** As the sulfamoylamine of general formula (IV), a sulfamoylamine in which each of R<sup>1</sup> and R<sup>2</sup> is a hydrogen atom can be produced by obtaining a sulfonamide derivative of general formula (IV-1) from a sulfenate derivative of general formula (VII-5) and hydroxylamine-O-sulfonic acid (XI) according to the method described in Synthesis, 1985, 1032, and then subjecting the sulfonamide derivative to deprotection in the same manner as in (A). Such a sulfamoylamine of general formula (IV) can be produced also by obtaining a sulfonamide derivative of general formula (IV-1) from a sulfenate derivative of general formula (VII-5) and a N-halo-substituted amine of general formula (XII) according to the method described in J. Org. Chem., 46, 5077 (1981), and then subjecting the sulfonamide derivative to deprotection in the same manner as in (A).

50 **[0036]** Typical compounds as the sulfonamide derivative of general formula (I) are listed below in Table 1 and Table 2 but they are not intended in any way to limit the scope of the present invention. In the following tables, "n" is a prefix for "normal", "s" is a prefix for "secondary", "t" is a prefix for "tertiary", "i" is a prefix for "iso", "c" is a prefix for "cyclo", and "Me" indicates a methyl group, "Et" an ethyl group, "Pr" a propyl group, "Bu" a butyl group, "Pen" a pentyl group, "Hex" a hexyl group, "Ph" a phenyl group, "Py" a pyridyl group, and "C\*" an asymmetric carbon atom. In addition, "J<sup>1</sup>", "J<sup>2</sup>" and "J<sup>3</sup>" indicate the following substituents.

55



General formula (I-1)

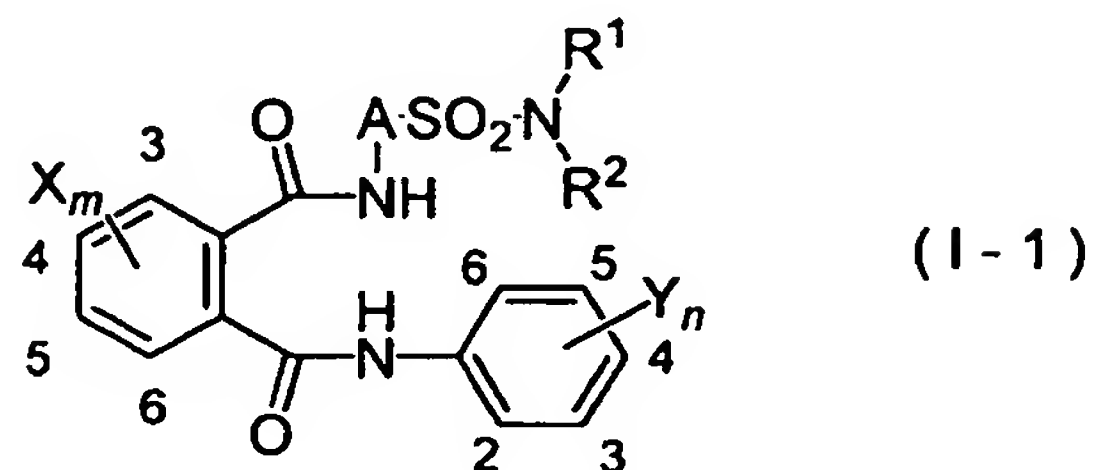


Table 1

No.	-A-SO <sub>2</sub> NR <sup>1</sup> R <sup>2</sup>	X <sub>m</sub>	Y <sub>n</sub>	Physical property: Melting point °C
1-1	CHMeCH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>	3-I	2-Me-4-CF(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	217-219
1-2	CHMeCH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> NHMe	3-I	2-Me-4-CF(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	186-188
1-3	CHMeCH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> NMe <sub>2</sub>	3-I	2-Me-4-CF(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	122-125
1-4	CHMeCH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> NHEt	3-I	2-Me-4-CF(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	170-172
1-5	CHMeCH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> N(Me)Et	3-I	2-Me-4-CF(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	
1-6	CHMeCH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> NEt <sub>2</sub>	3-I	2-Me-4-CF(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	116
1-7	CHMeCH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> NH-n-Pr	3-I	2-Me-4-CF(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	147-150
1-8	CHMeCH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> NH-i-Pr	3-I	2-Me-4-CF(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	204-206
1-9	CHMeCH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> NH-c-Pr	3-I	2-Me-4-CF(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	
1-10	CHMeCH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> N(n-Pr) <sub>2</sub>	3-I	2-Me-4-CF(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	
1-11	CHMeCH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> N(i-Pr) <sub>2</sub>	3-I	2-Me-4-CF(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	
1-12	CHMeCH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> NH-n-Bu	3-I	2-Me-4-CF(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	178-181
1-13	CHMeCH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> NH-s-Bu	3-I	2-Me-4-CF(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	
1-14	CHMeCH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> NH-t-Bu	3-I	2-Me-4-CF(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	195-197
1-15	CHMeCH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> NH-i-Bu	3-I	2-Me-4-CF(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	
1-16	CHMeCH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> NH-c-Bu	3-I	2-Me-4-CF(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	
1-17	CHMeCH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> NH-c-Pen	3-I	2-Me-4-CF(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	
1-18	CHMeCH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> NH-c-Hex	3-I	2-Me-4-CF(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	
1-19	CHMeCH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> NHCH <sub>2</sub> -c-Pr	3-I	2-Me-4-CF(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	
1-20	CHMeCH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> NHCH <sub>2</sub> CH=CH <sub>2</sub>	3-I	2-Me-4-CF(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	109-113
1-21	CHMeCH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> NHCH <sub>2</sub> C≡CH	3-I	2-Me-4-CF(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	111-113
1-22	CHMeCH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> NHCH <sub>2</sub> Ph	3-I	2-Me-4-CF(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	200-202
1-23	CHMeCH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> NHCH <sub>2</sub> -(2-F-Ph)	3-I	2-Me-4-CF(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	195-198
1-24	CHMeCH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> NHCH <sub>2</sub> -(2-Cl-Ph)	3-I	2-Me-4-CF(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	193-196
1-25	CHMeCH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> NHCH <sub>2</sub> -(2-Br-Ph)	3-I	2-Me-4-CF(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	189-192
1-26	CHMeCH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> NHCH <sub>2</sub> -(2-Me-Ph)	3-I	2-Me-4-CF(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	
1-27	CHMeCH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> NHCH <sub>2</sub> -(2-OMe-Ph)	3-I	2-Me-4-CF(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	180-183

Table 1 (continued)

	No.	-A-SO <sub>2</sub> NR <sup>1</sup> R <sup>2</sup>	Xm	Yn	Physical property: Melting point °C
5	1-28	CHMeCH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> NHCH <sub>2</sub> -(2-NO <sub>2</sub> -Ph)	3-I	2-Me-4-CF(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	173-177
	1-29	CHMeCH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> NHCH <sub>2</sub> -(3-OMe-Ph)	3-I	2-Me-4-CF(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	196-198
	1-30	CHMeCH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> NHCH <sub>2</sub> -(3-NO <sub>2</sub> -Ph)	3-I	2-Me-4-CF(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	155-160
	1-31	CHMeCH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> NHCH <sub>2</sub> -(3-CN-Ph)	3-I	2-Me-4-CF(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	147-150
10	1-32	CHMeCH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> NHCH <sub>2</sub> -(2,6-(OMe) <sub>2</sub> -Ph)	3-I	2-Me-4-CF(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	210-213
	1-33	CHMeCH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> NHCH <sub>2</sub> -(4-Cl-Ph)	3-I	2-Me-4-CF(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	
	1-34	CHMeCH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> NHCH <sub>2</sub> -(4-Me-Ph)	3-I	2-Me-4-CF(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	
	1-35	CHMeCH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> NHCH <sub>2</sub> -(4-MeO-Ph)	3-I	2-Me-4-CF(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	176-179
15	1-36	CHMeCH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> NHCH <sub>2</sub> -(4-NO <sub>2</sub> -Ph)	3-I	2-Me-4-CF(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	185-187
	1-37	CHMeCH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> NHCH <sub>2</sub> -(4-CN-Ph)	3-I	2-Me-4-CF(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	169-171
	1-38	CHMeCH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> NHCH <sub>2</sub> -(4-SCF <sub>3</sub> -Ph)	3-I	2-Me-4-CF(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	201-204
	1-39	CHMeCH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> NHCH <sub>2</sub> -2-Py	3-I	2-Me-4-CF(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	228-231
20	1-40	CHMeCH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> NHCH <sub>2</sub> -3-Py	3-I	2-Me-4-CF(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	144-147
	1-41	CHMeCH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> NHCH <sub>2</sub> -4-Py	3-I	2-Me-4-CF(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	166-168
	1-42	CHMeCH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> N(Me)CH <sub>2</sub> Ph	3-I	2-Me-4-CF(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	186-189
	1-43	CHMeCH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> N(Et)CH <sub>2</sub> Ph	3-I	2-Me-4-CF(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	184-186
25	1-44	CHMeCH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> NHCH(Me) Ph	3-I	2-Me-4-CF(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	173-175
	1-45	CHMeCH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> NHC*H(Me) Ph R-enantiomer	3-I	2-Me-4-CF(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	168-170
	1-46	CHMeCH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> NHC*H(Me)Ph S-enantiomer	3-I	2-Me-4-CF(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	159-161
	1-47	CHMeCH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> NHCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> Ph	3-I	2-Me-4-CF(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	203-206
30	1-48	CHMeCH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> NHC(Me) <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> Ph	3-I	2-Me-4-CF(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	197-198
	1-49	CHMeCH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> N(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub>	3-I	2-Me-4-CF(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	
	1-50	CHMeCH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> N(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub>	3-I	2-Me-4-CF(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	
	1-51	CHMeCH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> N(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub>	3-I	2-Me-4-CF(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	
35	1-52	CHMeCH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> N(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub>	3-I	2-Me-4-CF(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	
	1-53	CHMeCH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> N(CH <sub>2</sub> ) <sub>6</sub>	3-I	2-Me-4-CF(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	
	1-54	CHMeCH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> N(CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> O	3-I	2-Me-4-CF(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	204-207
	1-55	CHMeCH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> N(CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> S	3-I	2-Me-4-CF(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	191-194
40	1-56	CHMeCH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> N(CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> SO	3-I	2-Me-4-CF(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	195-198
	1-57	CHMeCH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> N(CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> SO <sub>2</sub>	3-I	2-Me-4-CF(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	237-240
	1-58	CMe <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> N(CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> S	3-I	2-Me-4-CF(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	164-165
	1-59	CMe <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> N(CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> SO	3-I	2-Me-4-CF(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	167-168
45	1-60	CMe <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> N(CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> SO <sub>2</sub>	3-I	2-Me-4-CF(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	166-167
	1-61	CMe <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> J <sup>1</sup>	3-I	2-Me-4-CF(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	207-208
	1-62	CMe <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> J <sup>2</sup>	3-I	2-Me-4-CF(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	Amorphous
	1-63	CMe <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> J <sup>3</sup>	3-I	2-Me-4-CF(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	157-159
50	1-64	CHMeCH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> N(CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> NH	3-I	2-Me-4-CF(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	
	1-65	CHMeCH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> N(CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> NMe	3-I	2-Me-4-CF(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	
	1-66	CHMeCH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> N(CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> NCOMe	3-I	2-Me-4-CF(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	196-198
	1-67	CHMeCH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> N(CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> C=O	3-I	2-Me-4-CF(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	209-211
55	1-68	CHMeCH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> NHCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	3-I	2-Me-4-CF(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	
	1-69	CHMeCH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> NHCH (Me) CF <sub>3</sub>	3-I	2-Me-4-CF(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	
	1-70	CHMeCH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> NHCH <sub>2</sub> CH=CCl <sub>2</sub>	3-I	2-Me-4-CF(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	
	1-71	CHMeCH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> NH(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> Cl	3-I	2-Me-4-CF(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	90-95
	1-72	CHMeCH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> NH(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> OH	3-I	2-Me-4-CF(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	171-174
	1-73	CHMeCH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> NH(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> OMe	3-I	2-Me-4-CF(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	142-144

Table 1 (continued)

	No.	-A-SO <sub>2</sub> NR <sup>1</sup> R <sup>2</sup>	Xm	Yn	Physical property: Melting point °C
5	1-74	CHMeCH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> NHCHMeCH <sub>2</sub> OMe	3-I	2-Me-4-CF(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	
	1-75	CHMeCH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> NH(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> SMe	3-I	2-Me-4-CF(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	156-158
	1-76	CHMeCH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> NH(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> SOMe	3-I	2-Me-4-CF(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	132-134
	1-77	CHMeCH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> NH(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> Me	3-I	2-Me-4-CF(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	186-189
10	1-78	CMe <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> NH(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> OH	3-I	2-Me-4-CF(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	150-151
	1-79	CMe <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> NH(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> OMe	3-I	2-Me-4-CF(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	167-168
	1-80	CMe <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> NH(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> OCOMe	3-I	2-Me-4-CF(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	181-182
	1-81	CMe <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> NH(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> SMe	3-I	2-Me-4-CF(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	161-162
15	1-82	CMe <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> NH(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> SOMe	3-I	2-Me-4-CF(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	154-155
	1-83	CMe <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> NH(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> Me	3-I	2-Me-4-CF(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	151-152
	1-84	CMe <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> NH(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> SEt	3-I	2-Me-4-CF(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	166-167
	1-85	CMe <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> NH(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> SOEt	3-I	2-Me-4-CF(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	144-145
20	1-86	CMe <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> NH(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> Et	3-I	2-Me-4-CF(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	168-169
	1-87	CMe <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> NH(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> SPh	3-I	2-Me-4-CF(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	155-156
	1-88	CMe <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> NH(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> SOPh	3-I	2-Me-4-CF(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	151-153
	1-89	CMe <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> NH(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> Ph	3-I	2-Me-4-CF(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	170-172
25	1-90	CMe <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> NH(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> NMe <sub>2</sub>	3-I	2-Me-4-CF(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	
	1-91	CHMeCH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> NHCHMeCH <sub>2</sub> SMe	3-I	2-Me-4-CF(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	190-193
	1-92	CHMeCH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> NHCHMeCH <sub>2</sub> SOMe	3-I	2-Me-4-CF(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	130-133
	1-93	CHMeCH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> NHCHMeCH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> Me	3-I	2-Me-4-CF(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	150-154
30	1-94	CHMeCH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> NCMe <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SMe	3-I	2-Me-4-CF(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	157-160
	1-95	CHMeCH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> NH(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> OMe	3-I	2-Me-4-CF(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	
	1-96	CMe <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> NH(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> SMe	3-I	2-Me-4-CF(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	
	1-97	CMe <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> NH(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> SOMe	3-I	2-Me-4-CF(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	
35	1-98	CMe <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> NH(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> SO <sub>2</sub> Me	3-I	2-Me-4-CF(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	
	1-99	CHMeCH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> NHCH <sub>2</sub> CN	3-I	2-Me-4-CF(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	
	1-100	CHMeCH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> NHCH <sub>2</sub> CO <sub>2</sub> Me	3-I	2-Me-4-CF(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	
	1-101	CHMeCH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> NHCH <sub>2</sub> CO <sub>2</sub> Et	3-I	2-Me-4-CF(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	
40	1-102	CHMeCH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> NHCHMeCO <sub>2</sub> Me	3-I	2-Me-4-CF(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	
	1-103	CHMeCH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> NHCHMeCONH <sub>2</sub>	3-I	2-Me-4-CF(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	228-230
	1-104	CHMeCH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> NHCHMeCONHEt	3-I	2-Me-4-CF(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	176-177
	1-105	CHMeCH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> NHCH <sub>2</sub> CONEt <sub>2</sub>	3-I	2-Me-4-CF(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	172-174
45	1-106	CHMeCH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> NHPh	3-I	2-Me-4-CF(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	232-234
	1-107	CHMeCH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> NH(2-F-Ph)	3-I	2-Me-4-CF(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	211-212
	1-108	CHMeCH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> NH(2-MeO-Ph)	3-I	2-Me-4-CF(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	101-106
	1-109	CHMeCH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> NH(3-F-Ph)	3-I	2-Me-4-CF(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	235-236
50	1-110	CHMeCH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> NH(4-F-Ph)	3-I	2-Me-4-CF(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	228-233
	1-111	CHMeCH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> NH(4-MeO-Ph)	3-I	2-Me-4-CF(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	143-147
	1-112	CHMeCH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> NH(4-MeS-Ph)	3-I	2-Me-4-CF(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	165-170
	1-113	CHMeCH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> NH-2-Py	3-I	2-Me-4-CF(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	
55	1-114	CHMeCH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> NH-3-Py	3-I	2-Me-4-CF(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	
	1-115	CHMeCH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> NHOH	3-I	2-Me-4-CF(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	
	1-116	CHMeCH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> NHOMe	3-I	2-Me-4-CF(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	200-205
	1-117	CHMeCH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> NMeOMe	3-I	2-Me-4-CF(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	
55	1-118	CHMeCH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> NHNH <sub>2</sub>	3-I	2-Me-4-CF(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	
	1-119	CHMeCH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> NMeNH <sub>2</sub>	3-I	2-Me-4-CF(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	
	1-120	CHMeCH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> NMeNHMe	3-I	2-Me-4-CF(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	
	1-121	CHMeCH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> NHNMe <sub>2</sub>	3-I	2-Me-4-CF(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	161-166
	1-122	CHMeCH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> NHNHPh	3-I	2-Me-4-CF(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	

Table 1 (continued)

No.	-A-SO <sub>2</sub> NR <sup>1</sup> R <sup>2</sup>	Xm	Yn	Physical property: Melting point °C
5	1-123 CHMeCH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> NHNHCOMe	3-I	2-Me-4-CF(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	
	1-124 CHMeCH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> NHNHCOPh	3-I	2-Me-4-CF(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	
	1-125 CHMeCH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> NHN=OMe <sub>2</sub>	3-I	2-Me-4-CF(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	
	1-126 CHMeCH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> NHN=CHPh	3-I	2-Me-4-CF(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	
	1-127 CHMeCH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> NHN=C(Me)Ph	3-I	2-Me-4-CF(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	
10	1-128 CHMeCH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> N=CHMe	3-I	2-Me-4-CF(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	
	1-129 CHMeCH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> N=CHEt	3-I	2-Me-4-CF(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	
	1-130 CHMeCH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> N=CH-i-Pr	3-I	2-Me-4-CF(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	
	1-131 CHMeCH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> N=CHPh	3-I	2-Me-4-CF(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	
15	1-132 CHMeCH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> N=CHNHMe	3-I	2-Me-4-CF(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	
	1-133 CHMeCH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> N=CHNMe <sub>2</sub>	3-I	2-Me-4-CF(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	
	1-134 CHMeCH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> N=CHNEt <sub>2</sub>	3-I	2-Me-4-CF(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	
	1-135 C*HMeCH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> NH <sub>2</sub> R-enantiomer	3-I	2-Me-4-CF(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	
20	1-136 C*HMeCH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> NH <sub>2</sub> S-enantiomer	3-I	2-Me-4-CF(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	
	1-137 C*HMeCH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> NHMe R-enantiomer	3-I	2-Me-4-CF(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	
25	1-138 C*HMeCH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> NHMe S-enantiomer	3-I	2-Me-4-CF(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	
	1-139 C*HMeCH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> NMe <sub>2</sub> R-enantiomer	3-I	2-Me-4-CF(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	
	1-140 C*HMeCH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> NMe <sub>2</sub> S-enantiomer	3-I	2-Me-4-CF(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	
30	1-141 C*HMeCH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> NHEt R-enantiomer	3-I	2-Me-4-CF(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	
	1-142 C*HMeCH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> NHEt S-enantiomer	3-I	2-Me-4-CF(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	105-107
35	1-143 C*HMeCH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> NEt <sub>2</sub> R-enantiomer	3-I	2-Me-4-CF(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	
	1-144 C*HMeCH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> NEt <sub>2</sub> S-enantiomer	3-I	2-Me-4-CF(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	159-163
40	1-145 C*HMeCH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> NHCH <sub>2</sub> Ph R-enantiomer	3-I	2-Me-4-CF(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	
	1-146 C*HMeCH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> NHCH <sub>2</sub> Ph S-enantiomer	3-I	2-Me-4-CF(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	158-159
	1-147 C*HMeCH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> NHC*HMeCH <sub>2</sub> SMe S, S-enantiomer	3-I	2-Me-4-CF(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	Amorphous
45	1-148 C*HMeCH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> NHC*HMeCH <sub>2</sub> SOMe S,S-enantiomer	3-I	2-Me-4-CF(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	115-120
	1-149 C*HMeCH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> NHC*HMeCH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> Me S,S-enantiomer	3-I	2-Me-4-CF(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	Amorphous
50	1-150 CHMeSO <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>	3-I	2-Me-4-CF(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	
	1-151 CHMeSO <sub>2</sub> NHMe	3-I	2-Me-4-CF(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	
	1-152 CHMeSO <sub>2</sub> NMe <sub>2</sub>	3-I	2-Me-4-CF(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	
	1-153 CHMeSO <sub>2</sub> NHEt	3-I	2-Me-4-CF(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	
	1-154 CHMeSO <sub>2</sub> NEt <sub>2</sub>	3-I	2-Me-4-CF(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	
55	1-155 CHMe(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>	3-I	2-Me-4-CF(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	
	1-156 CHMe(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> NHMe	3-I	2-Me-4-CF(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	
	1-157 CHMe(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> NMe <sub>2</sub>	3-I	2-Me-4-CF(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	



Table 1 (continued)

No.	-A-SO <sub>2</sub> NR <sup>1</sup> R <sup>2</sup>	Xm	Yn	Physical property: Melting point °C
5	1-158 CHMe(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> NHEt	3-I	2-Me-4-CF(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	
	1-159 CHMe(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> NEt <sub>2</sub>	3-I	2-Me-4-CF(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	
	1-160 C*HMe(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> NH <sub>2</sub> S-enantiomer	3-I	2-Me-4-CF(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	
	1-161 C*HMe(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> NHMe S-enantiomer	3-I	2-Me-4-CF(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	
10	1-162 C*HMe(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> NMe <sub>2</sub> S-enantiomer	3-I	2-Me-4-CF(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	
	1-163 C*HMe(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> NHEt S-enantiomer	3-I	2-Me-4-CF(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	
15	1-164 C*HMe(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> NEt <sub>2</sub> S-enantiomer	3-I	2-Me-4-CF(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	
	1-165 CHMe(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> SO <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>	3-I	2-Me-4-CF(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	
	1-166 CHMe(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> SO <sub>2</sub> NHMe	3-I	2-Me-4-CF(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	
20	1-167 CHMe(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> SO <sub>2</sub> NMe <sub>2</sub>	3-I	2-Me-4-CF(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	
	1-168 CHMe(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> SO <sub>2</sub> NHEt	3-I	2-Me-4-CF(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	
	1-169 CHMe(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> SO <sub>2</sub> NEt <sub>2</sub>	3-I	2-Me-4-CF(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	
	1-170 CHMe(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> SO <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>	3-I	2-Me-4-CF(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	
	1-171 CHMe(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> SO <sub>2</sub> NHMe	3-I	2-Me-4-CF(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	
25	1-172 CHMe(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> SO <sub>2</sub> NMe <sub>2</sub>	3-I	2-Me-4-CF(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	
	1-173 CHMe(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> SO <sub>2</sub> NHEt	3-I	2-Me-4-CF(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	
	1-174 CHMe(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> SO <sub>2</sub> NEt <sub>2</sub>	3-I	2-Me-4-CF(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	
	1-175 CMe <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>	3-I	2-Me-4-CF(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	Amorphous
30	1-176 CMe <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> NHMe	3-I	2-Me-4-CF(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	Amorphous
	1-177 CMe <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> NMe <sub>2</sub>	3-I	2-Me-4-CF(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	151-152
	1-178 CMe <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> NHEt	3-I	2-Me-4-CF(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	Amorphous
	1-179 CMe <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> NEt <sub>2</sub>	3-I	2-Me-4-CF(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	Amorphous
	1-180 CMe <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> NH-n-Bu	3-I	2-Me-4-CF(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	185-186
35	1-181 CMe <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> N(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub>	3-I	2-Me-4-CF(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	129-130
	1-182 CMe <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> NHCH <sub>2</sub> CH=CH <sub>2</sub>	3-I	2-Me-4-CF(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	152-153
	1-183 CMe <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> NHCH <sub>2</sub> C≡CH	3-I	2-Me-4-CF(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	
	1-184 CMe <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> NHCH <sub>2</sub> Ph	3-I	2-Me-4-CF(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	
40	1-185 CMe <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> NHPh	3-I	2-Me-4-CF(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	
	1-186 CMe <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> NH-2-Py	3-I	2-Me-4-CF(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	
	1-187 CMe <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>	3-I	2-Me-4-CF(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	
	1-188 CMe <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> NHMe	3-I	2-Me-4-CF(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	
	1-189 CMe <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> NMe <sub>2</sub>	3-I	2-Me-4-CF(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	
45	1-190 CMe <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> NHEt	3-I	2-Me-4-CF(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	
	1-191 CMe <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> NEt <sub>2</sub>	3-I	2-Me-4-CF(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	
	1-192 CMe <sub>2</sub> (CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>	3-I	2-Me-4-CF(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	
	1-193 CMe <sub>2</sub> (CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> NHMe	3-I	2-Me-4-CF(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	
50	1-194 CMe <sub>2</sub> (CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> NMe <sub>2</sub>	3-I	2-Me-4-CF(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	
	1-195 CMe <sub>2</sub> (CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> NHEt	3-I	2-Me-4-CF(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	
	1-196 CMe <sub>2</sub> (CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> NEt <sub>2</sub>	3-I	2-Me-4-CF(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	
	1-197 CMe <sub>2</sub> (CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> SO <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>	3-I	2-Me-4-CF(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	
	1-198 CMe <sub>2</sub> (CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> SO <sub>2</sub> NHMe	3-I	2-Me-4-CF(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	
55	1-199 CMe <sub>2</sub> (CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> SO <sub>2</sub> NMe <sub>2</sub>	3-I	2-Me-4-CF(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	
	1-200 CMe <sub>2</sub> (CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> SO <sub>2</sub> NHEt	3-I	2-Me-4-CF(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	185-186
	1-201 CMe <sub>2</sub> (CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> SO <sub>2</sub> NEt <sub>2</sub>	3-I	2-Me-4-CF(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	142-145

Table 1 (continued)

	No.	-A-SO <sub>2</sub> NR <sup>1</sup> R <sup>2</sup>	X <sub>m</sub>	Y <sub>n</sub>	Physical property: Melting point °C
5	1-202	CMe <sub>2</sub> (CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> SO <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>	3-I	2-Me-4-CF(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	
	1-203	CMe <sub>2</sub> (CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> SO <sub>2</sub> NHMe	3-I	2-Me-4-CF(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	
	1-204	CMe <sub>2</sub> (CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> SO <sub>2</sub> NMe <sub>2</sub>	3-I	2-Me-4-CF(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	
	1-205	CMe <sub>2</sub> (CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> SO <sub>2</sub> NHEt	3-I	2-Me-4-CF(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	
	1-206	CMe <sub>2</sub> (CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> SO <sub>2</sub> NEt <sub>2</sub>	3-I	2-Me-4-CF(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	
10	1-207	CHMeCH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> NHEt	H	2-Me-4-CF(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	120-121
	1-208	CMe <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> NEt <sub>2</sub>	H	2-Me-4-CF(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	93-94
	1-209	CHMeCH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> NHEt	3-F	2-Me-4-CF(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	
	1-210	CHMeCH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> NHEt	3-Cl	2-Me-4-CF(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	
15	1-211	CHMeCH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> NEt <sub>2</sub>	3-Cl	2-Me-4-CF(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	103-108
	1-212	CHMeCH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> NHEt	3-Br	2-Me-4-CF(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	136-138
	1-213	CHMeCH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> NMe <sub>2</sub>	3-Br	2-Me-4-CF(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	107-110
	1-214	CHMeCH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> NEt <sub>2</sub>	3-Br	2-Me-4-CF(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	112-115
	1-215	CHMeCH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> NH-n-Pr	3-Br	2-Me-4-CF(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	159-161
20	1-216	CHMeCH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> NH-i-Pr	3-Br	2-Me-4-CF(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	185-187
	1-217	CHMeCH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> NH-n-Bu	3-Br	2-Me-4-CF(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	179-181
	1-218	CHMeCH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> NHCH <sub>2</sub> Ph	3-Br	2-Me-4-CF(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	139-141
	1-219	CMe <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> NEt <sub>2</sub>	3-Br	2-Me-4-CF(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	169-170
25	1-220	CHMeCH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> NHEt	3,4-Cl <sub>2</sub>	2-Me-4-CF(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	
	1-221	CHMeCH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> NHEt	3,4-Br <sub>2</sub>	2-Me-4-CF(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	
	1-222	CHMeCH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> NHEt	4-Cl	2-Me-4-CF(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	
	1-223	CHMeCH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> NHEt	4-Br	2-Me-4-CF(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	
	1-224	CHMeCH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> NHEt	4-I	2-Me-4-CF(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	
30	1-225	CHMeCH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> NHEt	3-NO <sub>2</sub>	2-Me-4-CF(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	
	1-226	CHMeCH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> NHEt	3-NH <sub>2</sub>	2-Me-4-CF(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	
	1-227	CHMeCH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> NHEt	3-N(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	2-Me-4-CF(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	
	1-228	CHMeCH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> NHEt	3-NHCOCH <sub>3</sub>	2-Me-4-CF(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	
35	1-229	CHMeCH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> NHEt	3-NHCOCF <sub>3</sub>	2-Me-4-CF(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	
	1-230	CHMeCH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> NHEt	3-NHSO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	2-Me-4-CF(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	
	1-231	CHMeCH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> NHEt	3-NHSO <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	2-Me-4-CF(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	
	1-232	CHMeCH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> NHEt	3-CH <sub>3</sub>	2-Me-4-CF(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	
	1-233	CHMeCH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> NHEt	3-CF <sub>3</sub>	2-Me-4-CF(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	
40	1-234	CHMeCH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> NHEt	3-OCH <sub>3</sub>	2-Me-4-CF(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	
	1-235	CHMeCH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> NHEt	3-OCF <sub>3</sub>	2-Me-4-CF(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	
	1-236	CHMeCH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> NHEt	3-OCOCH <sub>3</sub>	2-Me-4-CF(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	
	1-237	CHMeCH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> NHEt	3-OCOCF <sub>3</sub>	2-Me-4-CF(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	
45	1-238	CHMeCH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> NHEt	3-SCH <sub>3</sub>	2-Me-4-CF(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	
	1-239	CHMeCH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> NHEt	3-SOCH <sub>3</sub>	2-Me-4-CF(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	
	1-240	CHMeCH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> NHEt	3-SO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	2-Me-4-CF(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	
	1-241	CHMeCH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> NHEt	3-SCF <sub>3</sub>	2-Me-4-CF(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	
	1-242	CHMeCH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> NHEt	3-SOCF <sub>3</sub>	2-Me-4-CF(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	
50	1-243	CHMeCH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> NHEt	3-SO <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	2-Me-4-CF(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	
	1-244	CHMeCH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> NHEt	3-OSO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	2-Me-4-CF(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	
	1-245	CHMeCH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> NHEt	3-OSO <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	2-Me-4-CF(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	
	1-246	CHMeCH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> NHEt	3-C≡CH	2-Me-4-CF(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	
55	1-247	CHMeCH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> NHEt	3-C≡OCF <sub>3</sub>	2-Me-4-CF(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	
	1-248	CHMeCH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> NHEt	3-CN	2-Me-4-CF(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	
	1-249	CHMeCH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> NHEt	3-CHCHCHCH-4	2-Me-4-CF(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	
	1-250	CHMeCH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> NHEt	3-OCF <sub>2</sub> O-4	2-Me-4-CF(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	

Table 1 (continued)

	No.	-A-SO <sub>2</sub> NR <sup>1</sup> R <sup>2</sup>	Xm	Yn	Physical property: Melting point °C
5	1-251	CHMeCH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> NHEt	3-OCF <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> O-4	2-Me-4-CF(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	Amorphous 114-118 164-166
	1-252	CHMeCH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> NHEt	3-I	2-Me-4-F	
	1-253	CHMeCH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> NHEt	3-I	2-Me-4-Cl	
	1-254	CHMeCH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> NHEt	3-I	2-Me-4-Br	
	1-255	CHMeCH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> NHEt	3-I	2-Me-4-I	
10	1-256	CHMeCH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> NHEt	3-I	2-Me-3-F-4-Cl	
	1-257	CHMeCH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> NHEt	3-I	2-Me-3-Cl-4-F	
	1-258	CHMeCH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> NHEt	3-I	2-Me-3,4-Cl <sub>2</sub>	
	1-259	CHMeCH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> NHEt	3-I	2-Me-3-Cl-4-Br	
15	1-260	CHMeCH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> NHEt	3-I	2-Me-3-Cl-4-I	
	1-261	CHMeCH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> NHEt	3-I	2,4-Cl <sub>2</sub>	
	1-262	CHMeCH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> NHEt	3-I	2-Cl-4-Br	
	1-263	CHMeCH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> NHEt	3-I	2-Cl-4-I	
	1-264	CHMeCH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> NHEt	3-I	2,4-Br <sub>2</sub>	
20	1-265	CHMeCH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> NHEt	3-I	2-Br-4-I	
	1-266	CHMeCH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> NHEt	3-I	2,3,4-Cl <sub>3</sub>	
	1-267	CHMeCH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> NEt <sub>2</sub>	3-I	2,3,4-Cl <sub>3</sub>	
	1-268	CMe <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> NEt <sub>2</sub>	3-I	2,3,4-Cl <sub>3</sub>	
25	1-269	CHMeCH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> NHEt	3-I	2,3-Cl <sub>2</sub> -4-F	
	1-270	CHMeCH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> NHEt	3-I	2,3-Cl <sub>2</sub> -4-Br	
	1-271	CHMeCH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> NHEt	3-I	2,3-Cl <sub>2</sub> -4-I	
	1-272	CHMeCH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> NHEt	3-I	2,4-Cl <sub>2</sub> -3-Br	
	1-273	CHMeCH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> NHEt	3-I	2,4-Cl <sub>2</sub> -3-F	
30	1-274	CHMeCH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> NHEt	3-I	2-Me-4-OCHF <sub>2</sub>	181-182 Amorphous Amorphous
	1-275	CHMeCH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> NHEt	3-I	2-Me-4-OCF <sub>3</sub>	
	1-276	CHMeCH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> NEt <sub>2</sub>	3-I	2-Me-4-OCF <sub>3</sub>	
	1-277	CMe <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> NEt <sub>2</sub>	3-I	2-Me-4-OCF <sub>3</sub>	
35	1-278	CHMeCH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> NHEt	3-I	2-Me-4-OCF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	
	1-279	CHMeCH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> NHEt	3-I	2-Me-4-OCF <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub>	
	1-280	CHMeCH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> NHEt	3-I	2-Me- 4-OCF <sub>2</sub> CHFCF <sub>3</sub>	
	1-281	CHMeCH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> NHEt	3-I	2-Me- 4-OCF <sub>2</sub> CHFOCF <sub>3</sub>	
40	1-282	CHMeCH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> NHEt	3-I	2-Me- 4-OCF <sub>2</sub> CHFOC <sub>3</sub> F <sub>7</sub> - n	
	1-283	CHMeCH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> NHEt	3-I	2-Cl-4-OCHF <sub>2</sub>	
45	1-284	CHMeCH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> NHEt	3-I	2-Cl-4-OCF <sub>3</sub>	100-103 141-142
	1-285	CHMeCH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> NEt <sub>2</sub>	3-I	2-Cl-4-OCF <sub>3</sub>	
	1-286	CMe <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> NEt <sub>2</sub>	3-I	2-Cl-4-OCF <sub>3</sub>	
	1-287	CHMeCH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> NHEt	3-I	2-Cl-4-OCF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	
50	1-288	CHMeCH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> NHEt	3-I	2-Cl-4-OCF <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub>	
	1-289	CHMeCH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> NHEt	3-I	2-Cl- 4-OCF <sub>2</sub> CHFCF <sub>3</sub>	
	1-290	CHMeCH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> NHEt	3-I	2-Cl- 4-OCF <sub>2</sub> CHFOCF <sub>3</sub>	
55	1-291	CHMeCH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> NHEt	3-I	2-Cl- 4-OCF <sub>2</sub> CHFOC <sub>3</sub> F <sub>7</sub> - n	

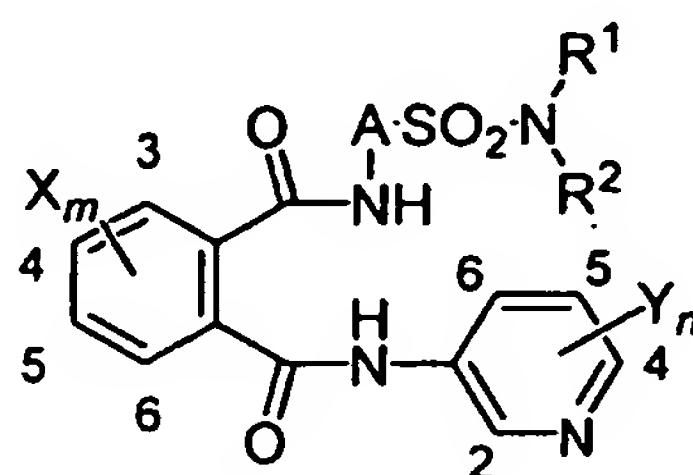
Table 1 (continued)

	No.	-A-SO <sub>2</sub> NR <sup>1</sup> R <sup>2</sup>	Xm	Yn	Physical property: Melting point °C
5	1-292	CHMeCH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> NHEt	3-I	2,3-Cl <sub>2</sub> -4-OCF <sub>3</sub>	
	1-293	CHMeCH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> NHEt	3-I	2,3-Cl <sub>2</sub> - 4-OCF <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub>	
	1-294	CHMeCH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> NHEt	3-I	2,3-Cl <sub>2</sub> - 4-OCF <sub>2</sub> CHFCF <sub>3</sub>	
10	1-295	CHMeCH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> NHEt	3-I	2,3-Cl <sub>2</sub> - 4-OCF <sub>2</sub> CHFOCF <sub>3</sub>	
	1-296	CHMeCH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> NHEt	3-I	2,3-Cl <sub>2</sub> - 4-OCF <sub>2</sub> CHFOC <sub>3</sub> F <sub>7</sub> - n	
15	1-297	CHMeCH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> NHEt	3-I	4-CF <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	
	1-298	CHMeCH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> NHEt	3-I	4-CF(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	
	1-299	CHMeCH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> NHEt	3-I	2-Me-4-CF <sub>3</sub>	
	1-300	CHMeCH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> NHEt	3-I	2-Me-4-CF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	
20	1-301	CHMeCH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> NEt <sub>2</sub>	3-I	2-Me-4-CF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	118-120
	1-302	CMe <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> NEt <sub>2</sub>	3-I	2-Me-4-CF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	Amorphous
	1-303	CMe <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> NHCH <sub>2</sub> Ph	3-I	2-Me-4-CF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	153-154
	1-304	CMe <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> NHCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SMe	3-I	2-Me-4-CF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	164-166
	1-305	CMe <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> NHCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SOMe	3-I	2-Me-4-CF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	150-152
25	1-306	CMe <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> NHCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> Me	3-I	2-Me-4-CF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	139-142
	1-307	CMe <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> NHCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SEt	3-I	2-Me-4-CF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	159-160
	1-308	CMe <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> NHCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SOEt	3-I	2-Me-4-CF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	198-199
	1-309	CMe <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> NHCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> Et	3-I	2-Me-4-CF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	133-134
30	1-310	CMe <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> NHCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SPh	3-I	2-Me-4-CF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	144-145
	1-311	CHMeCH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> NHEt	3-I	2-Me-4-CF <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	
	1-312	CHMeCH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> NHEt	3-I	2-Cl-4-CF <sub>3</sub>	
	1-313	CHMeCH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> NHEt	3-I	2-F-4-CF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	
	1-314	CHMeCH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> NHEt	3-I	2-Cl-4-CF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	
35	1-315	CHMeCH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> NHEt	3-I	2-Cl-4-CF <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	
	1-316	CHMeCH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> NHEt	3-I	2-F-4-CF(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	
	1-317	CHMeCH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> NHEt	3-I	2-Cl-4-CF(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	
	1-318	CHMeCH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> NHEt	3-I	2-Br-4-CF(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	
40	1-319	CHMeCH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> NHEt	3-I	2-I-4-CF(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	
	1-320	CHMeCH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> NHEt	3-I	2-Et-4-CF(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	
	1-321	CHMeCH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> NHEt	3-I	2-n-Pr-4-CF(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	
	1-322	CHMeCH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> NHEt	3-I	2-i-Pr-4-CF(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	
	1-323	CHMeCH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> NHEt	3-I	2-t-Bu-4-CF(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	
45	1-324	CHMeCH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> NHEt	3-I	2-Ph-4-CF(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	
	1-325	CHMeCH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> NHEt	3-I	2-CH <sub>2</sub> OH-4-CF (CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	
	1-326	CHMeCH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> NHEt	3-I	2-CH <sub>2</sub> OMe-4-CF (CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	
50	1-327	CHMeCH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> NHEt	3-I	2-OMe-4-CF(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	
	1-328	CHMeCH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> NHEt	3-I	2-SMe-4-CF(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	
	1-329	CHMeCH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> NHEt	3-I	2-N(Me) <sub>2</sub> -4-CF (CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	
55	1-330	CHMeCH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> NHEt	3-I	2-NO <sub>2</sub> -4-CF(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	
	1-331	CHMeCH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> NHEt	3-I	2-CF <sub>3</sub> -4-CF(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	
	1-332	CHMeCH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> NHEt	3-I	2-CHO-4-CF(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	

Table 1 (continued)

No.	-A-SO <sub>2</sub> NR <sup>1</sup> R <sup>2</sup>	X <sub>m</sub>	Y <sub>n</sub>	Physical property: Melting point °C
1-333	CHMeCH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> NHEt	3-I	2-CN-4-CF(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	214-216 232-234 Amorphous Amorphous
1-334	CHMeCH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> NHEt	3-I	2-COMe-4-CF(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	
1-335	CHMeCH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> NHEt	3-I	2,3-(Me) <sub>2</sub> -4-CF(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	
1-336	CHMeCH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> NHEt	3-I	2-Me-3-F-4-CF(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	
1-337	CHMeCH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> NHEt	3-I	2-Me-3-Cl-4-CF(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	
1-338	CHMeCH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> NHEt	3-I	2-Me-3-OH-4-CF(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	
1-339	CHMeCH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> NHEt	3-I	2-Me-3-OMe-4-CF(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	
1-340	CHMeCH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> NHEt	3-I	2-Me-5-F-4-CF(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	
1-341	CHMeCH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> NHEt	3-I	2-Me-5-Cl-4-CF(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	
1-342	CHMeCH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>	3-I	2-Me-4-CH(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	
1-343	CHMeCH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> NHEt	3-I	2-Me-4-CH(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	
1-344	CMe <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> NEt <sub>2</sub>	3-I	2-Me-4-CH(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	
1-345	CMe <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> N(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub>	3-I	2-Me-4-CH(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	
1-346	CHMeCH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> NHEt	3-I	2-Me-4-C(OH)(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	
1-347	CHMeCH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> NHEt	3-I	2-Me-4-C(OMe)(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	
1-348	CHMeCH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> NHEt	3-I	2-Me-4-C(OEt)(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	
1-349	CHMeCH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> NHEt	3-I	2-OCF <sub>2</sub> O-3-4-CF(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	
1-350	CHMeCH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> NHEt	3-I	2-OCH <sub>2</sub> O-3-4-CF(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	
1-351	CHMeCH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> NHEt	3-I	2-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -3-4-CF(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	
1-352	CHMeCH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> NHEt	3-I	2-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -3-4-CF(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	
1-353	CHMeCH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> NHEt	3-I	2-Me-4-CF(CF <sub>3</sub> )CF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	

General formula (I-2)



(I-2)



Table 2

No.	-A-SO <sub>2</sub> NR <sup>1</sup> R <sup>2</sup>	Xm	Yn	Physical property: Melting point °C
2-1	CHMeCH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> NHEt	3-I	4-CF(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	Amorphous
2-2	CHMeCH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>	3-I	2-Me-4-CF(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	
2-3	CHMeCH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> NHMe	3-I	2-Me-4-CF(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	
2-4	CHMeCH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> NMe <sub>2</sub>	3-I	2-Me-4-CF(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	
2-5	CHMeCH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> NHEt	3-I	2-Me-4-CF(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	
2-6	CHMeCH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> NEt <sub>2</sub>	3-I	2-Me-4-CF(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	
2-7	CMe <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> NEt <sub>2</sub>	3-I	2-Me-4-CF(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	
2-8	CHMeCH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> NHEt	3-I	2-Cl-4-CF(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	
2-9	CHMeCH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> NHEt	3-I	2-OMe-4-CF(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	
2-10	CHMeCH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> NHEt	3-I	2-SMe-4-CF(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	
2-11	CHMeCH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> NHEt	3-I	2-SOMe-4-CF(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	Amorphous
2-12	CHMeCH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> NHEt	3-I	2-SO <sub>2</sub> Me-4-CF(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	
2-13	CHMeCH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> NHEt	3-I	2-Et-4-CF(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	
2-14	CHMeCH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> NHEt	3-I	2-n-Pr-4-CF(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	
2-15	CHMeCH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> NHEt	3-I	4-CH(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	
2-16	CHMeCH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> NHEt	3-I	2-Me-4-CH(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	
2-17	CHMeCH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> NHEt	3-I	2-Cl-4-CH(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	
2-18	CHMeCH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> NHEt	3-I	2-OMe-4-CH(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	
2-19	CHMeCH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> NHEt	3-I	2-SMe-4-CH(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	
2-20	CHMeCH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> NHEt	3-I	2-SOMe-4-CH(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	
2-21	CHMeCH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> NHEt	3-I	2-SO <sub>2</sub> Me-4-CH(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	
2-22	CHMeCH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> NHEt	3-I	2-Et-4-CH(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	
2-23	CHMeCH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> NHEt	3-I	2-n-Pr-4-CH(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	

Table 3 shows <sup>1</sup>H-NMR data of compounds having a physical property expressed by the word "amorphous" in Table 1 and Table 2.

Table 3

No.	NMRdata <sup>1</sup> H-NMR[CDCl <sub>3</sub> (or DMSO- d <sub>6</sub> )/TMS, δvalues (ppm)]
1-62 (CDCl <sub>3</sub> )	1.30(d,3H),1.60(s,6H),2.38(s,3H),2.80(m,2H), 3.30(m,3H), 3.43(s,2H),4.00(m,1H),4.50(m,1H),6.45 (br,1H),7.25(m,1H), 7.48(m,2H),7.76(d,1H), 7.98(d,1H),8.29(d,1H),8.40(br,1H)
1-147 (CDCl <sub>3</sub> )	1.09(d,3H),1.44(d,3H),2.05(s,3H),2.37(s,3H), 2.43(m,2H), 3.32(m,2H),3.63(m,1H),4.63(m,1H), 5.46 (br,1H),6.70(br,1H), 7.21(t,1H),7.36(d,1H), 7.44(s,1H),7.70(d,1H),7.90(m,2H), 8.64(br,1H)
1-149 (CDCl <sub>3</sub> )	1.19(d,3H),1.37(d,3H),2.33(s,3H),2.83(s,3H), 3.52(m,2H), 3.27(d,2H),3.98(m,1H),4.55(m,1H),5.98 (br,1H),6.88(br,1H), 7.11(t,1H),7.33(d,1H),7.42(s,1H),7.60(m,1H),7.83(m,2H), 8.89(br,1H)
1-175 (DMSO-d <sub>6</sub> )	1.49(s,6H),2.35(s,3H),3.65(s,2H),6.91(br,2H), 7.25(m,1H), 7.51(d,1H),7.52(s,1H),7.70(d,1H), 7.78 (d,1H),7.99(d,1H), 8.29(s,1H),9.87(br,1H)
1-176 (CDCl <sub>3</sub> )	1.63(s,6H),2.39(s,3H),2.56(d,3H),3.41(s,2H), 4.21(br,1H), 6.48(br,1H),7.20(m,1H),7.47(m,2H), 7.74 (d,1H),7.99(d,1H), 8.30(br,1H),8.32(d,1H)
1-178 (CDCl <sub>3</sub> )	1.01(t,3H),1.61(s,6H),2.38(s,3H),2.98(q,2H), 3.40(s,2H), 4.52(br,1H),6.63(br,1H),7.19(m,1H), 7.43 (m,2H),7.71(d,1H), 7.95(d,1H),8.21(d,1H), 8.46(br,1H)
1-179 (CDCl <sub>3</sub> )	1.08(t,6H),1.61(s,6H),2.34(s,3H),3.12(q,4H),3.21(s,2H), 6.75(br,1H),7.20(m,1H),7.43(m,2H),7.75 (d,1H),7.96(d,1H), 8.37(d,1H),8.50(br,1H)
1-266 (DMSO-d <sub>6</sub> )	1.00(t,3H),1.28(d,3H),2.84(m,4H),4.27(m,1H),7.14(br,1H), 7.28(m,1H),7.67(m,3H),8.03(d,1H),8.52 (d,1H),10.14(br,1H)
1-276 (CDCl <sub>3</sub> )	1.10(t,6H), 1.46(d,3H), 2.31(s,3H), 3.15(m,5H),3.67(m,1H), 4.60(m,1H), 6.80(br,1H), 7.04(s,1H), 7.21(t,1H),7.25(d,1H), 7.74(d,1H), 7.95(d,1H),8.01(d,1H),8.26(br,1H)
1-277 (CDCl <sub>3</sub> )	1.11(t,6H),1.63(s,6H),2.33(s,3H),3.14(q,4H),3.20(s,2H), 6.67(br,1H),7.12(d,1H),7.21(m,2H),7.77(d, 1H),7.97(d,1H), 8.18(d,1H),8.30(br,1H)

Table 3 (continued)

No.	NMRdata <sup>1</sup> H-NMR[CDCl <sub>3</sub> (or DMSO- d <sub>6</sub> )/TMS, δvalues (ppm)]
1-302 (CDCl <sub>3</sub> )	1.10(t,6H),1.62(s,6H),2.38(s,3H),3.12(q,4H),3.16(s,2H), 6.68(br,1H),7.22(m,1H),7.43(m,2H),7.79(d,1H),7.99(d,1H), 8.43(br,1H),8.45(d,1H)
1-344 (CDCl <sub>3</sub> )	1.09(t,6H),1.62(s,6H),2.35(s,3H),3.13(q,4H),3.20(s,2H), 3.99(m,1H),6.63(br,1H),7.26(m,3H),7.78(d,1H),7.98(d,1H), 8.33(d,1H),8.35(br,1H)
1-345 (CDCl <sub>3</sub> )	1.63(s,6H),1.78(m,4H),2.35(s,3H),3.19(m,4H),3.26(s,2H), 3.99(m,1H),6.68(br,1H),7.23(m,3H),7.77(d,1H),7.98(d,1H), 8.31(d,1H),8.33(br,1H)
2-5 (CDCl <sub>3</sub> )	1.05(t,3H),1.47(d,3H),2.59(s,3H),3.05(m,2H),3.25(d,2H), 4.50(m,1H),5.05(br,1H),6.65(br,1H),7.25(m,1H),7.45(d,1H), 7.73(d,1H),7.97(d,1H)8.33(d,1H),8.63(br,1H)
2-7 (CDCl <sub>3</sub> )	1.08(t,6H),1.63(s,6H),2.62(s,3H),3.12(q,4H),3.18(s,2H), 6.79(br,1H),7.22(m,1H),7.53(d,1H),7.77(d,1H),7.98(d,1H), 8.73(d,1H),8.78(br,1H)
2-16 (CDCl <sub>3</sub> )	1.01(t,3H),1.46(d,3H),2.55(s,3H),3.03(m,2H),3.24(d,2H), 4.40(m,2H),5.10(br,1H),6.65(br,1H),7.25(m,2H),7.71(d,1H), 7.93(d,1H),8.14(d,1H),8.74(br,1H)

## EXAMPLES

**[0037]** Typical examples of the present invention are described below but they should not be construed as limiting the scope of the invention.

## Example 1

Production of N<sup>2</sup>-(2-ethylsulfamoyl-1-methylethyl)-3-iodo-N<sup>1</sup>-(2-methyl-4-[1,2,2,2-tetrafluoro-1-(trifluoromethyl)ethyl]phenyl)phthalamide (compound No. 1-4)

**[0038]** (1-1) In tetrahydrofuran (500 ml) was dissolved 22.53 g (300 mmol) of 2-aminopropanol, and then 155.1 g (300 mmol) of a 30% solution of carbobenzoxy chloride in toluene and a solution of 36.43 g (360 mmol) of triethylamine in tetrahydrofuran were slowly dropped thereinto under ice-cooling. After the resulting mixture was stirred at room temperature for 3 hours, the triethylamine hydrochloride precipitated was filtered under reduced pressure and washed with ethyl acetate. The filtrate was concentrated under reduced pressure and diluted hydrochloric acid was added thereto, followed by three runs of extraction with ethyl acetate. The organic layer was washed with saturated aqueous sodium hydrogencarbonate solution and then saturated aqueous sodium chloride solution, dried over anhydrous sodium sulfate, and then distilled to remove the solvent, whereby 49.8 g (yield 79%) of benzyl (2-hydroxy-1-methylethyl) carbamate was obtained.

**[0039]** (1-2) In tetrahydrofuran (400 ml) were dissolved 46.5 g (222 mmol) of benzyl (2-hydroxy-1-methylethyl)carbamate and 26.96 g (266 mmol) of triethylamine, and a solution of 27.96 g (244 mmol) of methanesulfonyl chloride in tetrahydrofuran was slowly dropped thereinto at 0°C. After the resulting mixture was stirred at room temperature for 5 hours, the triethylamine hydrochloride precipitated was filtered under reduced pressure and washed with ethyl acetate. The filtrate was concentrated under reduced pressure and water was added thereto, followed by three runs of extraction with ethyl acetate. The extract solution was washed with saturated aqueous sodium hydrogencarbonate solution and then saturated aqueous sodium chloride solution, and dried over anhydrous sodium sulfate. The solvent was distilled off and the crude crystals thus obtained were washed twice with a solvent (hexane : ethyl acetate = 4 : 1) to obtain 49.5 g (yield 78%) of 2-(benzyloxycarbonylamino)propyl methanesulfonate.

**[0040]** (1-3) In ethanol (120 ml) was dissolved 34.9 g (120 mmol) of 2-(benzyloxycarbonylamino)propyl methanesulfonate, followed by adding dropwise thereto a thiolate separately prepared from 14.42 g (120 mmol) of thioglycolic acid and a solution of sodium ethoxide (120 mmol) in ethanol. The reaction was carried out at room temperature for 30 minutes and then at 50°C for 2 hours, after which the solvent was distilled off and water was added to the residue, followed by three runs of extraction with ethyl acetate. The extract solution was washed with saturated aqueous sodium hydrogencarbonate solution and then saturated aqueous sodium chloride solution, and dried over anhydrous sodium sulfate. The solvent was distilled off and the resulting residue was purified by silica gel column chromatography (hexane : ethyl acetate = 4 : 1) to obtain 34.5 g (yield 92%) of 2-(benzyloxycarbonylamino)propylthioacetic acid.

**[0041]** (1-4) In ethyl acetate (150 ml) was dissolved 34.5 g (110 mmol) of 2-(benzyloxycarbonylamino)propylthioacetic acid, and a solution (50 ml) of 23.9 g (110 mmol) of m-chloroperbenzoic acid in ethyl acetate was slowly dropped thereinto at 0°C. After the reaction was carried out at room temperature for 3 hours, the reaction solution was poured into saturated aqueous sodium hydrogencarbonate solution, followed by extraction with ethyl acetate. The extract

solution was washed three times with saturated aqueous sodium hydrogencarbonate solution and then once with saturated aqueous sodium chloride solution, and dried over anhydrous sodium sulfate. The solvent was distilled off and the crude crystals thus obtained were washed twice with a solvent (hexane : ethyl acetate = 2 : 1) to obtain 30.38 g (yield 84%) of 2-(benzyloxycarbonylamino)propylsulfinylacetic acid.

5 [0042] (1-5) In methanol (300 ml) was suspended 30.38 g (93 mmol) of 2-(benzyloxycarbonylamino)propylsulfinylacetic acid, followed by adding thereto 19.04 g (75 mmol) of iodine, and the reaction was carried out with refluxing for 5 hours. An aqueous sodium hydrogensulfite solution was added to the reaction mixture to reduce the excess iodine, after which the solution thus obtained was made weakly basic with saturated aqueous sodium hydrogencarbonate solution and sodium hydrogencarbonate and the methanol was distilled off. Water was added to the residue, followed  
10 by three runs of extraction with ethyl acetate. The extract solution was washed with saturated aqueous sodium chloride solution and dried over anhydrous sodium sulfate.

[0043] The solvent was distilled off and the thus obtained crude bis[2-(benzyloxycarbonylamino)propyl]-disulfide (29 mmol, estimated from <sup>1</sup>H-NMR integral ratio) was suspended in ethanol (150 ml), followed by adding thereto 15.66 g (88 mmol) of N-bromosuccinimide in small portions. The reaction was carried out at room temperature for 3 hours,  
15 after which the reaction solution was made weakly basic with saturated aqueous sodium hydrogencarbonate solution and sodium hydrogencarbonate and the ethanol was distilled off. Water was added to the residue, followed by three runs of extraction with ethyl acetate. The extract solution was washed three times with water and then once with saturated aqueous sodium chloride solution and dried over anhydrous sodium sulfate. The solvent was distilled off and the resulting residue was purified by silica gel column chromatography (hexane : ethyl acetate = 2 : 1) to obtain 16.0  
20 g (yield 60%) of ethyl 2-(benzyloxycarbonylamino)propane-1-sulfinate.

[0044] (1-6) In ethanol (7 ml) was dissolved 2.2 g (7.4 mmol) of ethyl 2-(benzyloxycarbonylamino)propane-1-sulfinate, and 3.2 g (8 mmol) of 10% aqueous sodium hydroxide solution was slowly dropped thereinto under ice-cooling. The reaction was carried out at room temperature for 1 hour, after which the ethanol was distilled off and water was added to the residue, followed by two runs of extraction with methyl t-butyl ether. The aqueous layer was acidified with  
25 concentrated hydrochloric acid, followed by three runs of extraction with ethyl acetate. The extract solution was washed with saturated aqueous sodium chloride solution and dried over anhydrous sodium sulfate. The solvent was distilled off and the crude crystals thus obtained were washed twice with a solvent (hexane : ethyl acetate = 4 : 1) to obtain 1.73 g (yield 91%) of 2-(benzyloxycarbonylamino)propane-1-sulfinic acid.

[0045] (1-7) In water (10 ml) was dissolved 0.52 g (3.8 mmol) of potassium carbonate and 1.73 g (6.7 mmol) of  
30 2-(benzyloxycarbonylamino)propane-1-sulfinic acid was added thereto, after which 1.07 g (6.7 mmol) of bromine was added dropwise thereto (water was properly added because crystals were precipitated during the dropwise addition to make stirring difficult). After stirring at room temperature for 30 minutes, the crystals were filtered and then washed with water to obtain 2.30 g (quantitative) of 2-(benzyloxycarbonylamino)propane-1-sulfonyl bromide.

[0046] (1-8) A solution (5 ml) of 1.44 g (3.3 mmol) of 2-(benzyloxycarbonylamino)propane-1-sulfonyl bromide in tetrahydrofuran was added dropwise to 70% aqueous ethylamine solution (10 ml) under ice-cooling. The reaction was carried out at room temperature for 1 hour, after which the reaction mixture was poured into diluted hydrochloric acid, followed by three runs of extraction with ethyl acetate. The extract solution was washed with saturated aqueous sodium  
35 chloride solution and dried over anhydrous sodium sulfate. The solvent was distilled off to obtain crude N-ethyl-2-(benzyloxycarbonylamino)propane-1-sulfonamide, and this crude product was used without further purification in the subsequent reaction.

[0047] (1-9) In a bottle for pressure hydrogenation, the inner atmosphere of which had been replaced with argon, was placed 0.07 g of 10%Pd-C, and suspended by adding ethanol (10 ml) thereto all at once. Then, a solution (20 ml) of the crude N-ethyl-2-(benzyloxycarbonylamino)propane-1-sulfonamide obtained in (1-8) in ethanol was added thereto and the reaction was carried out for 10 hours under pressure (hydrogen pressure: 4 kg/cm<sup>2</sup>) (during the reaction, the  
45 pressure was reduced for reducing the partial pressure of carbon monoxide produced, and then was re-increased). The reaction solution was filtered with Celite and washed with ethanol, and the filtrate was concentrated under reduced pressure. The crystals thus obtained were washed twice with a solvent (hexane : ethyl acetate = 2 : 1) to obtain 0.27 g {yield from 2-(benzyloxycarbonylamino)propane-1-sulfonyl bromide: 50%} of N-ethyl-2-aminopropane-1-sulfonamide.

50 [0048] (1-10) In acetonitrile (100 ml) was dissolved 5.5 g (20 mmol) of 3-iodophthalic anhydride, and a solution (20 ml) of 5.5 g (20 mmol) of 2-methyl-4-[1,2,2,2-tetrafluoro-1-(trifluoromethyl)ethyl]aniline in acetonitrile was slowly dropped thereinto. After the resulting mixture was stirred at room temperature for 3 hours, two-thirds of the acetonitrile was distilled off under reduced pressure and the crystals precipitated were filtered and then washed with acetonitrile to obtain 5.6 g (yield 51%) of 6-iodo-N-{2-methyl-4-[1,2,2,2-tetrafluoro-1-(trifluoromethyl)ethyl]phenyl}phthalamic acid.

55 [0049] (1-11) In methyl t-butyl ether (60 ml) was suspended 5.47 g (10 mmol) of 6-iodo-N-{2-methyl-4-[1,2,2,2-tetrafluoro-1-(trifluoromethyl)ethyl]phenyl}phthalamic acid, and a solution of 3.15 g (15 mmol) of trifluoroacetic anhydride in methyl t-butyl ether was slowly dropped thereinto. The resulting mixture was stirred at room temperature for 3 hours and then poured into ice water, followed by three runs of extraction with ethyl acetate. The extract



solution was washed twice with saturated aqueous sodium hydrogencarbonate solution and then once with saturated aqueous sodium chloride solution, and dried over anhydrous sodium sulfate. The solvent was distilled off and the crude crystals thus obtained were washed twice with a solvent (hexane : ethyl acetate = 4 : 1) to obtain 5.0 g (yield 94%) of 1,3-dihydro-7-iodo-3-{2-methyl-4-[1,2,2,2-tetrafluoro-1-(trifluoro-methyl)ethyl]phenylimino}-2-benzofuran-1-one.

5 [0050] (1-12) In acetonitrile (10 ml) was dissolved 0.42 g (0.8 mmol) of 1,3-dihydro-7-iodo-3-{2-methyl-4-[1,2,2,2-tetrafluoro-1-(trifluoromethyl)ethyl]phenylimino}-2-benzofuran-1-one, followed by adding thereto 0.13 g (0.8 mmol) of the N-ethyl-2-aminopropane-1-sulfonamide obtained in (1-9), and the reaction was carried out at room temperature for 10 hours. The solvent was distilled off and the crystals precipitated were filtered, and washed with acetonitrile and then with a mixed solvent (hexane : ethyl acetate = 4 : 1) to obtain 0.45 g (yield 81%) of N<sup>2</sup>-(2-ethylsulfa-

10 moyl-1-methylethyl)-3-iodo-N<sup>1</sup>-{2-methyl-4-[1,2,2,2-tetrafluoro-1-(trifluoromethyl)ethyl]phenyl}phthalamide.

[0051] Melting point: 170-172°C.

#### Example 2

15 Production of 3-iodo-N<sup>1</sup>-{2-methyl-4-[1,2,2,2-tetrafluoro-1-(trifluoromethyl)ethyl]phenyl}-N<sup>2</sup>-(2-sulfamoyl-1,1-dimethylethyl)phthalamide (compound No. 1-175)

[0052] (2-1) In tetrahydrofuran (300 ml) was dissolved 23.86 g (200 mmol) of 1,1-dimethyl-2-(methylthio)ethylamine, and 103.4 g (200 mmol) of a 30% solution of carbobenzoxy chloride in toluene and then a solution of 24.29 g (240  
20 mmol) of triethylamine in tetrahydrofuran were slowly dropped thereinto under ice-cooling. After the resulting mixture was stirred at room temperature for 3 hours, the triethylamine hydrochloride precipitated was filtered under reduced pressure and washed with ethyl acetate. The filtrate was concentrated under reduced pressure and the residue was purified by silica gel column chromatography (hexane : ethyl acetate = 4 : 1) to obtain 36.35 g (yield 72%) of benzyl 1,1-dimethyl-2-(methylthio)ethylcarbamate.

25 [0053] (2-2) To a solution of 45.4 g (179 mmol) of benzyl 1,1-dimethyl-2-(methylthio)ethylcarbamate in aqueous methanol (obtained by adding 5.22 g (290 mmol) of water to 150 ml of methanol) was added 33.46 g (188 mmol) of N-bromosuccinimide in small portions with stirring. The reaction was carried out at room temperature for 2 hours, after which the reaction solution was made weakly basic with saturated aqueous sodium hydrogencarbonate solution and then the methanol was distilled off. Water was added to the residue, followed by three runs of extraction with ethyl  
30 acetate. The extract solution was washed three times with water and then once with saturated aqueous sodium chloride solution, and dried over anhydrous sodium sulfate. The solvent was distilled off and the thus obtained crude benzyl 1,1-dimethyl-2-(methylsulfinyl)ethylcarbamate was dissolved in acetic anhydride (150 ml), and the reaction was carried out with refluxing for 4 hours. The excess acetic anhydride and acetic acid were distilled off under reduced pressure to obtain a residue containing crude [2-(benzyloxycarbonylamino)-2-methylpropyl]thiomethyl acetate. This residue was  
35 dissolved in methanol (300 ml), followed by adding thereto 19.54 g (77 mmol) of iodine, and the reaction was carried out with refluxing for 5 hours. After the reaction mixture was cooled to room temperature, an aqueous sodium hydrogensulfite solution was added thereto to reduce the excess iodine. The reaction solution was made weakly basic with saturated aqueous sodium hydrogencarbonate solution, after which the methanol was distilled off. Water was added to the residue, followed by three runs of extraction with ethyl acetate. The extract solution was washed with saturated  
40 aqueous sodium chloride solution and dried over anhydrous sodium sulfate. The solvent was distilled off and the resulting residue was purified by silica gel column chromatography (hexane : ethyl acetate = 4 : 1) to obtain 10.0 g (yield 23%) of bis[2-(benzyloxycarbonylamino)-2-methylpropyl]-disulfide.

[0054] (2-3) In ethanol (150 ml) was dissolved 10.0 g (21 mmol) of bis[2-(benzyloxycarbonylamino)-2-methylpropyl] disulfide, and 11.21 g (63 mmol) of N-bromosuccinimide was added thereto in small portions with stirring. The reaction  
45 was carried out at room temperature for 2 hours, after which the reaction solution was made weakly basic with saturated aqueous sodium hydrogencarbonate solution and the ethanol was distilled off. Water was added to the residue, followed by three runs of extraction with ethyl acetate. The extract solution was washed three times with water and then once with saturated aqueous sodium chloride solution and dried over anhydrous sodium sulfate. The solvent was distilled off and the resulting residue was purified by silica gel column chromatography (hexane : ethyl acetate = 2 : 1) to obtain  
50 10.45 g (yield 83%) of ethyl 2-(benzyloxycarbonylamino)-2-methylpropane-1-sulfinate.

[0055] (2-4) In ethanol (10 ml) was dissolved 0.60 g (2 mmol) of ethyl 2-(benzyloxycarbonylamino)-2-methylpropane-1-sulfinate, and 0.9 g (2.2 mmol) of 10% aqueous sodium hydroxide solution was slowly dropped thereinto under ice-cooling. The reaction was carried out at room temperature for 1 hour and then the ethanol was distilled off. Water (10 ml), 0.18 g (2.2 mmol) of sodium acetate and 0.25 g (2.2 mmol) of hydroxylamine-O-sulfonic acid were added to the  
55 residue, and the reaction was carried out at room temperature for 1 hour. The reaction mixture was poured into water, followed by three runs of extraction with ethyl acetate. The extract solution was washed with saturated aqueous sodium hydrogencarbonate solution and then saturated aqueous sodium chloride solution, and dried over anhydrous sodium sulfate. The solvent was distilled off and 0.49 g (yield 86%) of the thus obtained crude 2-(benzyloxycarbonylamino)-

2-methylpropane-1-sulfonamide was used without further purification in the subsequent reaction.

[0056] (2-5) In a bottle for pressure hydrogenation, the inner atmosphere of which had been replaced with argon, was placed 0.20 g of 10%Pd-C, and suspended by adding acetic acid (5 ml) thereto all at once. Then, a solution (10 ml) of the 2-(benzyloxycarbonylamino)-2-methylpropane-1-sulfonamide obtained in (2-4) in acetic acid was added thereto and the reaction was carried out for 10 hours under pressure (hydrogen pressure: 4 kg/cm<sup>2</sup>) (during the reaction, the pressure was reduced for reducing the partial pressure of carbon monoxide produced, and then was re-increased). The reaction solution was filtered with Celite and washed with ethanol, after which the filtrate was concentrated under reduced pressure and the residue (crude 2-amino-2-methylpropane-1-sulfonamide acetate) was used without further purification in the subsequent reaction.

[0057] (2-6) In acetonitrile (10 ml) was dissolved 0.8g (1.5 mmol) of 1,3-dihydro-7-iodo-3-(2-methyl-4-[1,2,2,2-tetrafluoro-1-(trifluoromethyl)ethyl]phenylimino)-2-benzofuran-1-one, followed by adding thereto the crude 2-amino-2-methylpropane-1-sulfonamide acetate obtained in (2-5) and 0.17 g (1.7 mmol) of triethylamine, and the reaction was carried out at room temperature for 30 hours. The solvent was distilled off and the resulting residue was purified by silica gel column chromatography (hexane : ethyl acetate = 1 : 1) to obtain 0.05 g (yield 9%) of 3-iodo-N<sup>1</sup>-(2-methyl-4-[1,2,2,2-tetrafluoro-1-(trifluoromethyl)ethyl]phenyl)-N<sup>2</sup>-(2-sulfamoyl-1,1-dimethylethyl)phthalamide as an amorphous substance.

<sup>1</sup>H-NMR [DMSO-d<sub>6</sub>/TMS, δ values (ppm)]

1.49(s, 6H), 2.35(s, 3H), 3.65(s, 2H), 6.91(br, 2H), 7.25(m, 1H), 7.51(d, 1H), 7.52(s, 1H), 7.70(d, 1H), 7.78(d, 1H), 7.99(d, 1H), 8.29(s, 1H), 9.87(br, 1H).

[0058] The agrohorticultural insecticides containing the sulfonamide derivative of general formula (I) or salt thereof of the present invention as an active ingredient are suitable for controlling various insect pests such as agrohorticultural insect pests, stored grain insect pests, sanitary insect pests, nematodes, etc., which are injurious to paddy rice, fruit trees, vegetables, other crops, flowers, ornamental plants, etc. They have a marked insecticidal effect, for example, on LEPIDOPTERA including summer fruit tortrix (*Adoxophyes orana fasciata*), smaller tea tortrix (*Adoxophyes* sp.), Manchurian fruit moth (*Grapholita inopinata*), oriental fruit moth (*Grapholita molesta*), soybean pod border (*Leguminivora glycinivorella*), mulberry leafroller (*Olethreutes mori*), tea leafroller (*Caloptilia theviva*), *Caloptilia* sp. (*Caloptilia zachrysa*), apple leafminer (*Phyllonorycter ringoniella*), pear barkminer (*Spulerrina astaurota*), common white (*Pieris rapae crucivora*), tobacco budworm (*Heliothis* sp.), codling moth (*Laspeyresia pomonella*), diamondback moth (*Plutella xylostella*), apple fruit moth (*Argyresthia conjugella*), peach fruit moth (*Carposina niponensis*), rice stem borer (*Chilo suppressalis*), rice leafroller (*Cnaphalocrocis medinalis*), tobacco moth (*Ephesia elutella*), mulberry pyralid (*Glyphodes pyloalis*), yellow rice borer (*Scirpophaga incertulas*), rice skipper (*Parnara guttata*), rice armyworm (*Pseudaletia separata*), pink borer (*Sesamia inferens*), common cutworm (*Spodoptera litura*), beet armyworm (*Spodoptera exigua*), etc.; HEMIPTERA including aster leafhopper (*Macrosteles fascifrons*), green rice leafhopper (*Nephotettix cincticeps*), brown rice planthopper (*Nilaparvata lugens*), whitebacked rice planthopper (*Sogatella furcifera*), citrus psylla (*Diaphorina citri*), grape whitefly (*Aleurolobus taonabae*), sweetpotato whitefly (*Bemisia tabaci*), greenhouse whitefly (*Trialeurodes vaporariorum*), turnup aphid (*Lipaphis erysimi*), green peach aphid (*Myzus persicae*), Indian wax scale (*Ceroplastes ceriferus*), cottony citrus scale (*Pulvinaria aurantii*), camphor scale (*Pseudaonidia duplex*), san Jose scale (*Comstockaspis perniciosus*), arrowhead scale (*Unaspis yanonensis*), etc.; TYLENCHIDA including soybean beetle (*Anomala rufocuprea*), Japanese beetle (*Popillia japonica*), tobacco beetle (*Lasioderma serricornis*), powderpost beetle (*Lyctus brunneus*), twenty-eight-spotted ladybird (*Epilachna vigintiotopunctata*), azuki bean weevil (*Callosobruchus chinensis*), vegetable weevil (*Listroderes costirostris*), maize weevil (*Sitophilus zeamais*), boll weevil (*Anthonomus grandis grandis*), rice water weevil (*Lissorhoptrus oryzophilus*), cucurbit leaf beetle (*Aulacophora femoralis*), rice leaf beetle (*Oulema oryzae*), striped flea beetle (*Phyllotreta striolata*), pine shoot beetle (*Tomicus piniperda*), Colorado potato beetle (*Leptinotarsa decemlineata*), Mexican bean beetle (*Epilachna varivestis*), corn rootworm (*Diabrotica* sp.), etc.; DIPTERA including melon fly (*Dacus*(*Zeugodacus*) *cucurbitae*), oriental fruit fly (*Dacus*(*Bactrocera*) *dorsalis*), rice leafminer (*Agromyza oryzae*), onion maggot (*Delia antiqua*), seedcorn maggot (*Delia platura*), soybean pod gall midge (*Asphondylia* sp.), muscid fly (*Musca domestica*), house mosquito (*Culex pipiens pipiens*), etc.; TYLENCHIDA including root-lesion nematode (*Pratylenchus* sp.), coffee root-lesion nematode (*Pratylenchus coffeae*), potato cyst nematode (*Globodera rostochiensis*), root-knot nematode (*Meloidogyne* sp.), citrus nematode (*Tylenchulus semipenetrans*), *Aphelenchus* sp. (*Aphelenchus avenae*), chrysanthemum foliar (*Aphelenchoides ritzemabosi*), etc.; and ACARINA including citrus red mite (*Panonychus citri*), European red mite (*Panonychus ulmi*), carmine spider mite (*Tetranychus cinnabarinus*), Kanzawa spider mite (*Tetranychus kanzawai* Kishida), two-spotted spider mite (*Tetranychus urticae* Koch), pink tea rust mite (*Acaphylla theae*), pink citrus rust mite (*Aculops pelekassi*), purple tea mite (*Calacar carinatus*), pear rust mite (*Epitrimerus pyri*), etc.

[0059] The agrohorticultural insecticide containing the sulfonamide derivative of general formula (I) or salt thereof of the present invention as an active ingredient has a marked controlling effect on the above-exemplified insect pests injurious to paddy field crops, upland crops, fruit trees, vegetables, other crops, flowers and ornamental plants, and the like. Therefore, the desired effect of the agrohorticultural insecticide of the present invention can be obtained by



applying the agrohorticultural insecticide to the seeds, paddy field water, stalks and leaves of fruit trees, vegetables, other crops, flowers and ornamental plants, soil, etc., at a season at which the insect pests are expected to appear, before their appearance or at the time when their appearance is confirmed.

[0060] The agrohorticultural insecticide of the present invention is generally prepared into conveniently usable forms according to an ordinary manner for preparation of agrochemicals.

[0061] That is, the sulfonamide derivative of general formula (I) or a salt thereof and, optionally, an adjuvant are blended with a suitable inert carrier in a proper proportion and prepared into a suitable preparation form such as a suspension, emulsifiable concentrate, soluble concentrate, wettable powder, granules, dust, tablets, pack or the like through dissolution, dispersion, suspension, mixing, impregnation, adsorption or sticking.

[0062] The inert carrier usable in the present invention may be either solid or liquid. As a material usable as the solid carrier, there can be exemplified soybean flour, cereal flour, wood flour, bark flour, saw dust, powdered tobacco stalks, powdered walnut shells, bran, powdered cellulose, extraction residues of vegetables, powdered synthetic polymers or resins, clay (e.g. kaolin, bentonite, and acid clay), talcs (e.g. talc and pyrophyllite), silica powders or flakes (e.g. diatomaceous earth, silica sand, mica and white carbon (synthetic, high-dispersion silicic acid, also called finely divided hydrated silica or hydrated silicic acid, some of commercially available products contain calcium silicate as the major component)), activated carbon, powdered sulfur, pumice, calcined diatomaceous earth, ground brick, fly ash, sand, calcium carbonate, calcium phosphate and other inorganic or mineral powders, plastic carriers (e.g. polyethylenes, polypropylenes and poly(vinylidene chloride)s), chemical fertilizers (e.g. ammonium sulfate, ammonium phosphate, ammonium nitrate, urea and ammonium chloride), and compost. These materials may be used alone or as a mixture of two or more thereof.

[0063] A material usable as the liquid carrier is selected from materials that have solubility in themselves or which are without such solubility but are capable of dispersing a compound as active ingredient with the aid of an adjuvant. The following are typical examples of the liquid carrier and can be used alone or as a mixture of two or more thereof: water; alcohols (e.g. methanol, ethanol, isopropanol, butanol and ethylene glycol), ketones (e.g. acetone, methyl ethyl ketone, methyl isobutyl ketone, diisobutyl ketone and cyclohexanone), ethers (e.g. ethyl ether, dioxane, Cellosolve, dipropyl ether and tetrahydrofuran), aliphatic hydrocarbons (e.g. kerosene and mineral oils), aromatic hydrocarbons (e.g. benzene, toluene, xylene, solvent naphtha and alkylnaphthalenes), halogenated hydrocarbons (e.g. dichloroethane, chloroform, carbon tetrachloride and chlorobenzene), esters (e.g. ethyl acetate, diisopropyl phthalate, dibutyl phthalate and dioctyl phthalate), amides (e.g. dimethylformamide, diethylformamide and dimethylacetamide), nitriles (e.g. acetonitrile), and dimethyl sulfoxide.

[0064] The following are typical examples of the adjuvant, which are used depending upon purposes and used alone or in combination in some cases, or need not be used at all.

[0065] To emulsify, disperse, dissolve and/or wet a compound as active ingredient, a surfactant is used. As the surfactant, there can be exemplified polyoxyethylene alkyl ethers, polyoxyethylene alkylaryl ethers, polyoxyethylene higher fatty acid esters, polyoxyethylene resins, polyoxyethylene sorbitan monolaurate, polyoxyethylene sorbitan monooleate, alkylarylsulfonates, naphthalenesulfonic acid condensation products, ligninsulfonates and higher alcohol sulfate esters.

[0066] Further, to stabilize the dispersion of a compound as active ingredient, tackify it and/or bind it, the adjuvants exemplified below may also be used, namely, there may also be used adjuvants such as casein, gelatin, starch, methyl cellulose, carboxymethyl cellulose, gum arabic, poly(vinyl alcohol)s, turpentine, bran oil, bentonite and ligninsulfonates.

[0067] To improve the flowability of a solid product, the following adjuvants may also be used, namely, there may be used adjuvants such as waxes, stearates, alkyl phosphates, etc.

[0068] Adjuvants such as naphthalenesulfonic acid condensation products and polycondensates of phosphates may be used as a peptizer for dispersible products.

[0069] Adjuvants such as silicone oil may also be used as a defoaming agent.

[0070] Further, if necessary, functional spreading agents, active enhancers such as metabolic decomposition inhibitor like piperonyl butoxide, antifreezing agents such as propylene glycol, antioxidants such as BHT, ultraviolet absorbers, and the like may also be added.

[0071] The content of the compound as active ingredient may be varied as required, and may be properly chosen in the range of 0.01 to 90 parts by weight per 100 parts by weight of the agrohorticultural insecticide. For example, in dusts or granules, the suitable content of the compound as active ingredient is from 0.01 to 50 parts by weight. In emulsifiable concentrates or flowable wettable powders, it is also from 0.01 to 50 parts by weight.

[0072] The agrohorticultural insecticide of the present invention is used to control a variety of insect pests in the following manner: it is applied to a crop on which the insect pests are expected to appear, or a site where appearance or growth of the insect pests is undesirable, as it is or after being properly diluted with or suspended in water or the like, in an amount effective for control of the insect pests.

[0073] The applying dosage of the agrohorticultural insecticide of the present invention is varied depending upon various factors such as a purpose, insect pests to be controlled, a growth stage of a plant, tendency of insect pests

appearance, weather, environmental conditions, a preparation form, an application method, an application site and application time. It may be properly chosen in the range of 0.001 g to 10 kg, preferably 0.01 g to 1 kg, (in terms of the compound as active ingredient) per 10 areas depending upon purposes.

[0074] The agrohorticultural insecticide of the present invention may be used in admixture with other agrohorticultural insecticides, acaricides, nematocides, fungicides, biotic pesticides or the like in order to expand both spectrum of controllable insect pest species and the period of time when effective application is possible or to reduce the dosage. Furthermore, the agrohorticultural insecticide of the present invention may be used in admixture with herbicides, plant growth regulators, fertilizers or the like, depending upon application situations.

[0075] Typical formulation examples and test examples of the present invention are described below but they should not be construed as limiting the scope of the invention.

[0076] As used in the formulation examples, the terms "part" and "parts" are by weight.

Formulation Example 1	
Each compound listed in Table 1 or 2	10 parts
Xylene	70 parts
N-methylpyrrolidone	10 parts
Mixture of polyoxyethylene nonylphenyl ether and calcium alkylbenzenesulfonate	10 parts

[0077] An emulsifiable concentrate was prepared by mixing uniformly the above ingredients to effect dissolution.

Formulation Example 2	
Each compound listed in Table 1 or 2	3 parts
Clay powder	82 parts
Diatomaceous earth powder	15 parts

[0078] A dust was prepared by mixing uniformly and grinding the above ingredients.

Formulation Example 3	
Each compound listed in Table 1 or 2	5 parts
Mixed powder of bentonite and clay	90 parts
Calcium ligninsulfonate	5 parts

[0079] Granules were prepared by mixing the above ingredients uniformly, and kneading the resulting mixture together with a suitable amount of water, followed by granulation and drying.

Formulation Example 4	
Each compound listed in Table 1 or 2	20 parts
Mixture of kaolin and synthetic high-dispersion silicic acid	75 parts
Mixture of polyoxyethylene nonylphenyl ether and calcium alkylbenzenesulfonate	5 parts

[0080] A wettable powder was prepared by mixing uniformly and grinding the above ingredients.

Test Example 1: Insecticidal effect on diamond back moth (*Plutella xylostella*)

[0081] Adult diamond back moths were released and allowed to oviposit on a Chinese cabbage seedling. Two days after the release, the seedling having the eggs deposited thereon was immersed for about 30 seconds in a liquid chemical prepared by diluting a preparation containing each compound listed in Table 1 or 2 as an active ingredient to adjust the concentration to 50 ppm. After air-dryness, it was allowed to stand in a room thermostated at 25°C.

[0082] Six days after the immersion, the hatched insects were counted. The mortality was calculated according to the following equation and the insecticidal effect was judged according to the criterion shown below. The test was

carried out with triplicate groups of 10 insects.

$$\text{Corrected mortality (\%)} = \frac{\frac{\text{Number of hatched insects in untreated group} - \text{Number of hatched insects in treated group}}{\text{Number of hatched insects in untreated group}}}{\text{Number of hatched insects in untreated group}} \times 100$$

Criterion for judgment:

- A --- Mortality 100%
- B --- Mortality 99-90%
- C --- Mortality 89-80%
- D --- Mortality 79-50%
- E --- Mortality less than 50%

[0083] The result of the above test is shown in Table 4 below.

Test Example 2: Insecticidal effect on common cutworm (*Spodoptera litura*)

[0084] A piece of cabbage leaf (cultivar: Shikidori) was immersed for about 30 seconds in a liquid chemical prepared by diluting a preparation containing each compound listed in Table 1 or 2 as an active ingredient to adjust the concentration to 50 ppm. After air-dryness, it was placed in a plastic Petri dish with a diameter of 9 cm and inoculated with second-instar larvae of common cutworm, after which the dish was closed and then allowed to stand in a room thermostated at 25°C. Eight days after the inoculation, the dead and alive were counted. The mortality was calculated according to the following equation and the insecticidal effect was judged according to the criterion shown in Test Example 1. The test was carried out with triplicate groups of 10 insects.

$$\text{Corrected mortality (\%)} = \frac{\frac{\text{Number of alive larvae in untreated group} - \text{Number of alive larvae in treated group}}{\text{Number of alive larvae in untreated group}}}{\text{Number of alive larvae in untreated group}} \times 100$$

[0085] The result of the above test is shown in Table 4 below.

Test Example 3: Insecticidal effect on smaller tea tortrix (*Adoxophyes sp.*)

[0086] Tea leaves were immersed for about 30 seconds in a liquid chemical prepared by diluting a preparation containing each compound listed in Table 1 or 2 as an active ingredient to adjust the concentration to 50 ppm. After air-dryness, the tea leaves were placed in a plastic Petri dish with a diameter of 9 cm and inoculated with larvae of smaller tea tortrix, after which the dish was allowed to stand in a room thermostated at 25°C and having a humidity of 70%. Eight days after the inoculation, the dead and alive were counted and the insecticidal effect was judged according to the criterion shown in Test Example 1. The test was carried out with triplicate groups of 10 insects.

[0087] The result of the above test is shown in Table 4 below.

Table 4

5

10

15

20

25

30

35

40

45

50

55

No	Test Example 1	Test Example 2	Test Example 3
1-1	A	A	A
1-2	A	A	A
1-3	A	A	A
1-4	A	A	A
1-6	A	A	A
1-7	A	A	A
1-8	A	A	A
1-12	A	A	A
1-14	A	A	A
1-20	A	A	A
1-21	A	A	A
1-22	A	A	A
1-23	A	A	A
1-24	A	A	A
1-25	A	A	A
1-27	A	A	A
1-28	A	A	A
1-29	A	A	A
1-30	A	A	A
1-31	A	A	A
1-32	A	A	A
1-35	A	A	A
1-36	A	A	A
1-37	A	A	A
1-38	A	A	A
1-39	A	A	A
1-40	A	A	A
1-41	A	A	A
1-42	A	A	A
1-43	A	A	A
1-44	A	A	A
1-45	A	A	A
1-46	A	A	A
1-47	A	A	A
1-48	A	C	A
1-54	A	A	A
1-55	A	A	A
1-56	A	A	A
1-57	A	A	A
1-58	A	A	E
1-59	A	A	E
1-60	A	A	E
1-61	A	A	A
1-62	A	A	A
1-63	A	A	A
1-66	A	A	A
1-67	A	E	E
1-71	A	A	A
1-72	A	A	A

EP 1 544 193 A1

Table 4 (continued)

	No	Test Example 1	Test Example 2	Test Example 3
	1-73	A	A	A
5	1-75	A	A	A
	1-76	A	A	A
	1-77	A	A	A
	1-78	A	E	A
	1-79	A	A	A
10	1-80	A	A	A
	1-81	A	A	A
	1-82	A	A	A
	1-83	A	A	A
15	1-84	A	A	A
	1-85	A	A	A
	1-86	A	A	A
	1-87	A	A	A
	1-88	A	A	A
20	1-89	A	A	A
	1-91	A	A	A
	1-92	A	A	A
	1-93	A	A	A
25	1-94	A	A	A
	1-103	A	A	A
	1-104	A	A	A
	1-105	A	A	E
	1-106	A	E	E
30	1-107	A	C	A
	1-108	A	A	A
	1-109	A	E	A
	1-110	A	E	E
35	1-111	A	E	E
	1-112	A	E	E
	1-116	A	D	A
	1-121	A	E	E
	1-142	A	A	A
40	1-144	A	A	A
	1-146	A	A	A
	1-147	A	A	A
	1-148	A	A	A
45	1-149	A	A	A
	1-175	A	A	A
	1-176	A	A	A
	1-177	A	A	A
	1-178	A	A	A
50	1-179	A	A	A
	1-180	A	C	A
	1-181	A	A	A
	1-184	A	A	A
55	1-200	A	A	A
	1-201	A	A	A
	1-207	A	A	E
	1-208	A	E	A

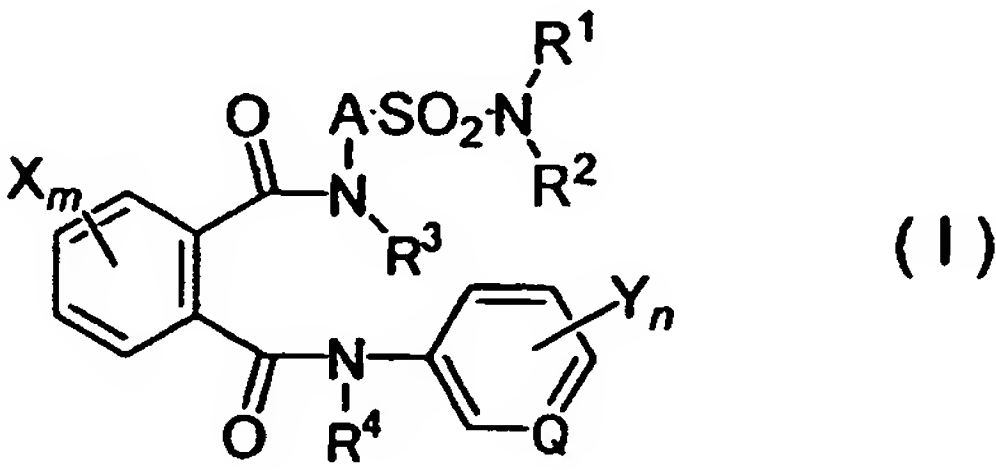


Table 4 (continued)

No	Test Example 1	Test Example 2	Test Example 3
1-211	A	A	A
1-212	A	A	A
1-213	A	A	A
1-214	A	A	A
1-215	A	A	A
1-216	A	A	A
1-217	A	A	A
1-218	A	A	A
1-219	A	A	A
1-266	A	C	E
1-267	A	C	E
1-268	A	A	A
1-275	A	E	E
1-276	A	E	E
1-277	A	A	A
1-285	A	C	B
1-286	A	A	E
1-301	A	A	A
1-302	A	A	A
1-303	A	A	A
1-304	A	A	A
1-305	A	A	A
1-306	A	A	A
1-307	A	A	A
1-308	A	A	A
1-309	A	A	A
1-310	A	A	A
1-342	A	A	A
1-343	A	A	A
1-344	A	A	A
1-345	A	A	A
2-5	A	A	A
2-7	A	A	A
2-16	A	E	A

Claims

1. A sulfonamide derivative represented by general formula (I), or a salt thereof:



wherein A is a (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkylene group; a substituted (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkylene group having one or more substituents which may be the same or different and are selected from halogen atoms, cyano group, nitro group, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkoxy groups, halo(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkoxy groups, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkylthio groups, halo(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkylthio groups, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkylsulfinyl groups, halo(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkylsulfinyl groups, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkylsulfonyl groups, halo(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkylsulfonyl groups, mono(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkylamino groups and di(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkylamino groups whose (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkyl groups may be the same or different; a (C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>)alkenylene group; a substituted (C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>)alkenylene group having one or more substituents which may be the same or different and are selected from halogen atoms, cyano group, nitro group, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkoxy groups, halo(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkoxy groups, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkylthio groups, halo(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkylthio groups, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkylsulfinyl groups, halo(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkylsulfinyl groups, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkylsulfonyl groups, halo(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkylsulfonyl groups, mono(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkylamino groups and di(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkylamino groups whose (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkyl groups may be the same or different; a (C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>)alkynylene group; or a substituted (C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>)alkynylene group having one or more substituents which may be the same or different and are selected from halogen atoms, cyano group, nitro group, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkoxy groups, halo(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkoxy groups, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkylthio groups, halo(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkylthio groups, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkylsulfinyl groups, halo(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkylsulfinyl groups, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkylsulfonyl groups, halo(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkylsulfonyl groups, mono(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkylamino groups and di(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkylamino groups whose (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkyl groups may be the same or different; any saturated carbon atom in the (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkylene group, substituted (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkylene group, (C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>)alkenylene group, substituted (C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>)alkenylene group, (C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>)alkynylene group or substituted (C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>)alkynylene group may be substituted by a (C<sub>2</sub>-C<sub>5</sub>)alkylene group so as to form a (C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>)cycloalkane ring, and any two carbon atoms in the (C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>)alkylene group, substituted (C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>)alkylene group, (C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>)alkenylene group or substituted (C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>)alkenylene group may be taken together with an alkylene group or an alkenylene group so as to represent a (C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>)cycloalkane ring or a (C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>)cycloalkene ring;

R<sup>1</sup> is a hydrogen atom; a (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkyl group; a substituted (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkyl group having one or more substituents which may be the same or different and are selected from halogen atoms, cyano group, nitro group, hydroxyl group, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkoxy groups, halo(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkoxy groups, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkylthio groups, halo(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkylthio groups, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkylsulfinyl groups, halo(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkylsulfinyl groups, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkylsulfonyl groups, halo(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkylsulfonyl groups, mono(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkylamino groups, mono(halo(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkyl)amino groups, di(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkylamino groups whose (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkyl groups may be the same or different, di(halo(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkyl)amino groups whose halo(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkyl groups may be the same or different, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkoxycarbonyl groups, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkylaminocarbonyl groups, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkylcarbonyloxy groups, phenoxy group, substituted phenoxy groups having one or more substituents which may be the same or different and are selected from halogen atoms, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkyl groups, halo(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkyl groups, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkoxy groups, halo(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkoxy groups, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkylthio groups, halo(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkylthio groups, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkylsulfinyl groups, halo(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkylsulfinyl groups, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkylsulfonyl groups, halo(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkylsulfonyl groups and (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkoxycarbonyl groups, phenylthio group, substituted phenylthio groups having one or more substituents which may be the same or different and are selected from halogen atoms, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkyl groups, halo(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkyl groups, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkoxy groups, halo(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkoxy groups, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkylthio groups, halo(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkylthio groups, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkylsulfinyl groups, halo(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkylsulfinyl groups, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkylsulfonyl groups, halo(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkylsulfonyl groups and (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkoxycarbonyl groups, phenyl group, substituted phenyl groups having one or more substituents which may be the same or different and are selected from halogen atoms, cyano group, nitro group, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkyl groups, halo(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkyl groups, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkoxy groups, halo(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkoxy groups, mono(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkylamino groups, di(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkylamino groups whose (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkyl groups may be the same or different, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkylthio groups, halo(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkylthio groups, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkylsulfinyl groups, halo(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkylsulfinyl groups, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkylsulfonyl groups, halo(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkylsulfonyl groups and (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkoxycarbonyl groups, pyridyl group, and substituted pyridyl groups having one or more substituents which may be the same or different and are selected from halogen atoms, cyano group, nitro group, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkyl groups, halo(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkyl groups, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkoxy groups, halo(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkoxy groups, mono(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkylamino groups, di(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkylamino groups whose (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkyl groups may be the same or different, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkylthio groups, halo(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkylthio groups, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkylsulfinyl groups, halo(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkylsulfinyl groups, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkylsulfonyl groups, halo(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkylsulfonyl groups and (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkoxycarbonyl groups; a (C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>)alkenyl group; a halo(C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>)alkenyl group; a (C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>)alkynyl group; a halo(C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>)alkynyl group; a (C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>)cycloalkyl group; a hydroxyl group; a (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkoxy group; a halo(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkoxy group; an amino group; a mono(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkylamino group; a mono(halo(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkyl)amino group; a di(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkylamino group whose (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkyl groups may be the same or different; a di(halo(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkyl)amino group whose halo(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkyl groups may be the same or different; a (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkylcarbonylamino group; a phenylamino group; a substituted phenylamino group having on the ring one or more substituents which may be the same or different and are selected from halogen atoms, cyano group, nitro group, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkyl groups, halo(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkyl groups, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkoxy groups, halo(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkoxy groups, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkylthio groups, halo(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkylthio groups, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkylsulfinyl groups, halo(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkylsulfinyl groups, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkylsulfonyl groups, halo(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkylsulfonyl groups, mono(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkylamino groups, mono(halo(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkyl)amino groups, di(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkylamino groups whose (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkyl groups may be the same or different, di(halo(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkyl)amino groups whose halo(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkyl

groups may be the same or different, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkoxycarbonyl groups and (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkylaminocarbonyl groups; a benzoylamino group; a substituted benzoylamino group having on the ring one or more substituents which may be the same or different and are selected from halogen atoms, cyano group, nitro group, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkyl groups, halo (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkyl groups, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkoxy groups, halo(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkoxy groups, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkylthio groups, halo(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkylthio groups, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkylsulfinyl groups, halo(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkylsulfinyl groups, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkylsulfonyl groups, halo (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkylsulfonyl groups, mono(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkylamino groups, mono(halo (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkyl)amino groups, di(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkylamino groups whose (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkyl groups may be the same or different, di(halo(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkyl)amino groups whose halo(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkyl groups may be the same or different, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkoxycarbonyl groups and (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkylaminocarbonyl groups; -N=C(T<sup>1</sup>)T<sup>2</sup> (wherein each of T<sup>1</sup> and T<sup>2</sup>, which may be the same or different, is a hydrogen atom, a (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkyl group, a halo(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkyl group, a phenyl group or a substituted phenyl group having one or more substituents which may be the same or different and are selected from halogen atoms, cyano group, nitro group, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkyl groups, halo(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkyl groups, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkoxy groups, halo(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkoxy groups, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkylthio groups, halo(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkylthio groups, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkylsulfinyl groups, halo(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkylsulfinyl groups, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkylsulfonyl groups, halo(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkylsulfonyl groups, mono(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkylamino groups, mono(halo(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkyl) amino groups, di(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkylamino groups whose (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkyl groups may be the same or different, di(halo(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkyl)amino groups whose halo(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkyl groups may be the same or different, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkoxycarbonyl groups and (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkylaminocarbonyl groups); a phenyl group; a substituted phenyl group having one or more substituents which may be the same or different and are selected from halogen atoms, cyano group, nitro group, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkyl groups, halo(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkyl groups, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkoxy groups, halo(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkoxy groups, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkylthio groups, halo(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkylthio groups, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkylsulfinyl groups, halo(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkylsulfinyl groups, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkylsulfonyl groups, halo(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkylsulfonyl groups, mono(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkylamino groups, mono(halo (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkyl)amino groups, di(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkylamino groups whose (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkyl groups may be the same or different, di(halo(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkyl)amino groups whose halo(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkyl groups may be the same or different, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkoxycarbonyl groups and (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkylaminocarbonyl groups; a pyridyl group; or a substituted pyridyl group having one or more substituents which may be the same or different and are selected from halogen atoms, cyano group, nitro group, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkyl groups, halo(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkyl groups, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkoxy groups, halo(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkoxy groups, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkylthio groups, halo(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkylthio groups, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkylsulfinyl groups, halo(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkylsulfinyl groups, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkylsulfonyl groups, halo (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkylsulfonyl groups, mono(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkylamino groups, mono (halo(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkyl)amino groups, di(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkylamino groups whose (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkyl groups may be the same or different, di(halo(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkyl)amino groups whose halo(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkyl groups may be the same or different, and (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkoxycarbonyl groups;

each of R<sup>2</sup>, R<sup>3</sup> and R<sup>4</sup>, which may be the same or different, is a hydrogen atom, a (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkyl group, a (C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>)alkenyl group, a (C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>)alkynyl group, a (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)alkoxy(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)alkyl group or a (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)alkylthio(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)alkyl group, R<sup>2</sup> being able to bind to A or R<sup>1</sup> to form a 3- to 8-membered ring which may contain one to three atoms that may be the same or different and are selected from oxygen atom, sulfur atom and nitrogen atom, and which ring may have one or more substituents that may be the same or different and are selected from halogen atoms, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkyl groups and (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkoxy groups, and R<sup>2</sup> being able to be taken together with R<sup>1</sup> to represent =C(T<sup>3</sup>)T<sup>4</sup> (wherein each of T<sup>3</sup> and T<sup>4</sup>, which may be the same or different, is a hydrogen atom, a (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkyl group, a halo(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkyl group, a (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkoxy group, a halo(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkoxy group, an amino group, a mono(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkylamino group, a di(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkylamino group whose (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkyl groups may be the same or different, a mono (halo (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkyl) amino group, a di(halo(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkyl)amino group whose halo(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkyl groups may be the same or different, a phenyl group or a substituted phenyl group having one or more substituents which may be the same or different and are selected from halogen atoms, cyano group, nitro group, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkyl groups, halo (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkyl groups, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkoxy groups, halo(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkoxy groups, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkylthio groups, halo(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkylthio groups, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkylsulfinyl groups, halo(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkylsulfinyl groups, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkylsulfonyl groups, halo(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkylsulfonyl groups, mono(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkylamino groups, mono(halo(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkyl) amino groups, di(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkylamino groups whose (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkyl groups may be the same or different, di(halo(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkyl)amino groups whose halo (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkyl groups may be the same or different, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkoxycarbonyl groups and (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkylaminocarbonyl groups);

Q is a carbon atom or a nitrogen atom;

each of Xs, which may be the same or different, is a halogen atom, a cyano group, a nitro group, an amino group, a (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkyl group, a halo(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkyl group, a (C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>)alkenyl group, a halo(C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>)alkenyl group, a (C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>)alkynyl group, a halo(C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>)alkynyl group, a (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkoxy group, a halo(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkoxy group, a (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkylcarbonyloxy group, a halo(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkylcarbonyloxy group, a (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkylthio group, a halo(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkylthio group, a (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkylsulfinyl group, a halo(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkylsulfinyl group, a (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkylsulfonyl group, a halo(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkylsulfonyl group, a (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkylsulfonyloxy group, a halo(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkylsulfonyloxy group, a mono(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkylamino group, a mono(halo(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkyl)amino group, a di(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkylamino group whose (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkyl groups may be the same or different, a di(halo(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkyl)amino group whose halo(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkyl groups may be the same or different, a (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkylcarbonylamino group, a halo(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkylcarbonylamino group, a (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkylsulfo-



nylamino group or a halo(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkylsulfonylamino group,

further, two adjacent Xs on the aromatic ring being able to be taken together to represent a fused ring that may have one or more substituents which may be the same or different and are selected from halogen atoms, nitro group, cyano group, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkyl groups, halo(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkyl groups, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkoxy groups, halo(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkoxy groups, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkylthio groups, halo(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkylthio groups, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkylsulfinyl groups, halo(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkylsulfinyl groups, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkylsulfonyl groups, halo(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkylsulfonyl groups, mono(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkylamino groups, mono(halo(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkyl)amino groups, di(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkylamino groups whose (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkyl groups may be the same or different, and di(halo(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkyl)amino groups whose halo(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkyl groups may be the same or different, m is an integer of 0 to 2;

each of Ys, which may be the same or different, is a halogen atom; a cyano group; a nitro group; a hydroxyl group; a formyl group; a (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkyl group; a hydroxy(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkyl group; a (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkoxy(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkyl group; a halo(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkoxy(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkyl group; a halo(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkyl group; a hydroxyhalo(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkyl group; a (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkoxyhalo(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkyl group; a halo(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkoxyhalo(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkyl group; a (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkoxy group; a halo(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkoxy group; a halo(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkoxyhalo(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkoxy group; a (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkylthio group; a halo(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkylthio group; a (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkylsulfinyl group; a halo(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkylsulfinyl group; a (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkylsulfonyl group; a halo(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkylsulfonyl group; a halo(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkoxyhalo(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkylthio group; a halo(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkoxyhalo(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkylsulfinyl group; a halo(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkoxyhalo(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkylsulfonyl group; a phenoxy group; a substituted phenoxy group having one or more substituents which may be the same or different and are selected from halogen atoms, cyano group, nitro group, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkyl groups, halo(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkyl groups, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkoxy groups, halo(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkoxy groups, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkylthio groups, halo(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkylthio groups, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkylsulfinyl groups, halo(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkylsulfinyl groups, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkylsulfonyl groups and halo(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkylsulfonyl groups; a phenylthio group; a substituted phenylthio group having one or more substituents which may be the same or different and are selected from halogen atoms, cyano group, nitro group, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkyl groups, halo(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkyl groups, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkoxy groups, halo(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkoxy groups, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkylthio groups, halo(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkylthio groups, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkylsulfinyl groups, halo(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkylsulfinyl groups, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkylsulfonyl groups and halo(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkylsulfonyl groups; a pyridyloxy group; or a substituted pyridyloxy group having one or more substituents which may be the same or different and are selected from halogen atoms, cyano group, nitro group, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkyl groups, halo(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkyl groups, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkoxy groups, halo(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkoxy groups, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkylthio groups, halo(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkylthio groups, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkylsulfinyl groups, halo(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkylsulfinyl groups, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkylsulfonyl groups and halo(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkylsulfonyl groups,

further, two adjacent Ys on the aromatic ring being able to be taken together to represent a fused ring that may have one or more substituents which may be the same or different and are selected from halogen atoms, nitro group, cyano group, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkyl groups, halo(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkyl groups, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkoxy groups, halo(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkoxy groups, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkylthio groups, halo(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkylthio groups, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkylsulfinyl groups, halo(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkylsulfinyl groups, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkylsulfonyl groups, halo(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkylsulfonyl groups, mono(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkylamino groups, mono(halo(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkyl)amino groups, di(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkylamino groups whose (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkyl groups may be the same or different, and di(halo(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkyl)amino groups whose halo(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkyl groups may be the same or different, and n is an integer of 0 to 3.

2. A sulfonamide derivative or a salt thereof according to claim 1, wherein A is a (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkylene group; a substituted (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkylene group having one or more substituents which may be the same or different and are selected from halogen atoms, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkoxy groups, halo(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkoxy groups, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkylthio groups, halo(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkylthio groups, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkylsulfinyl groups, halo(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkylsulfinyl groups, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkylsulfonyl groups and halo(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkylsulfonyl groups; a (C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>)alkenylene group; a substituted (C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>)alkenylene group having one or more substituents which may be the same or different and are selected from halogen atoms, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkoxy groups, halo(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkoxy groups, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkylthio groups, halo(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkylthio groups, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkylsulfinyl groups, halo(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkylsulfinyl groups, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkylsulfonyl groups and halo(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkylsulfonyl groups; a (C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>)alkynylene group; or a substituted (C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>)alkynylene group having one or more substituents which may be the same or different and are selected from halogen atoms, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkoxy groups, halo(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkoxy groups, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkylthio groups, halo(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkylthio groups, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkylsulfinyl groups, halo(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkylsulfinyl groups, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkylsulfonyl groups and halo(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkylsulfonyl groups; any saturated carbon atom in the (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkylene group, substituted (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkylene group, (C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>)alkenylene group, substituted (C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>)alkenylene group, (C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>)alkynylene group or substituted (C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>)alkynylene group may be substituted by a (C<sub>2</sub>-C<sub>5</sub>)alkylene group so as to form a (C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>)cycloalkane ring, and any two carbon atoms in the (C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>)alkylene group, substituted (C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>)alkylene group, (C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>)alkenylene group or substituted (C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>)alkenylene group may be taken together with an alkylene group or an alkenylene group so as to represent a (C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>)cycloalkane ring or a (C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>)cycloalkene ring;

R<sup>1</sup> is a hydrogen atom; a (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkyl group; a substituted (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkyl group having one or more substituents which may be the same or different and are selected from halogen atoms, cyano group, nitro group, hydroxyl group, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkoxy groups, halo(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkoxy groups, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkylthio groups, halo(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkylthio groups,



5

10

15

20

25

30

35

40

45

50

55

group, R<sup>2</sup> being able to bind to A or R<sup>1</sup> to form a 3- to 8-membered ring which may contain one to three atoms that may be the same or different and are selected from oxygen atom, sulfur atom and nitrogen atom, and which ring may have one or more substituents that may be the same or different and are selected from halogen atoms, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkyl groups and (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkoxy groups;

Q is a carbon atom or a nitrogen atom;

each of Xs, which may be the same or different, is a halogen atom, a cyano group, a nitro group, a (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkyl group, a halo(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkyl group, a (C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>)alkenyl group, a halo(C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>)alkenyl group, a (C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>)alkynyl group, a halo(C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>)alkynyl group, a (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkoxy group, a halo(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkoxy group, a (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkylcarbonyloxy group, a halo(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkylcarbonyloxy group, a (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkylthio group, a halo(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkylthio group, a (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkylsulfinyl group, a halo(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkylsulfinyl group, a (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkylsulfonyl group, a halo(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkylsulfonyl group, a (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkylsulfonyloxy group or a halo(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkylsulfonyloxy group, two adjacent Xs on the aromatic ring being able to be taken together to represent a fused ring that may have one or more substituents which may be the same or different and are selected from halogen atoms, nitro group, cyano group, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkyl groups, halo(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkyl groups, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkoxy groups, halo(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkoxy groups, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkylthio groups, halo(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkylthio groups, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkylsulfinyl groups, halo(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkylsulfinyl groups, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkylsulfonyl groups and halo(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkylsulfonyl groups, m is an integer of 0 to 2;

each of Ys, which may be the same or different, is a halogen atom; a cyano group; a nitro group; a hydroxyl group; a formyl group; a (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkyl group; a hydroxy(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkyl group; a (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkoxy(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkyl group; a halo(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkoxy(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkyl group; a halo(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkyl group; a hydroxyhalo(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkyl group; a (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkoxyhalo(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkyl group; a halo(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkoxyhalo(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkyl group; a (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkoxy group; a halo(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkoxy group; a halo(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkoxyhalo(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkoxy group; a (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkylthio group; a halo(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkylthio group; a (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkylsulfinyl group; a halo(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkylsulfinyl group; a (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkylsulfonyl group; a halo(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkylsulfonyl group; a halo(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkoxyhalo(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkylthio group; a halo(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkoxyhalo(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkylsulfinyl group; a halo(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkoxyhalo(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkylsulfonyl group; a phenoxy group; a substituted phenoxy group having one or more substituents which may be the same or different and are selected from halogen atoms, cyano group, nitro group, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkyl groups, halo(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkyl groups, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkoxy groups, halo(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkoxy groups, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkylthio groups, halo(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkylthio groups, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkylsulfinyl groups, halo(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkylsulfinyl groups, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkylsulfonyl groups and halo(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkylsulfonyl groups; a phenylthio group; a substituted phenylthio group having one or more substituents which may be the same or different and are selected from halogen atoms, cyano group, nitro group, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkyl groups, halo(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkyl groups, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkoxy groups, halo(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkoxy groups, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkylthio groups, halo(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkylthio groups, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkylsulfinyl groups, halo(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkylsulfinyl groups, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkylsulfonyl groups and halo(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkylsulfonyl groups; a pyridyloxy group; or a substituted pyridyloxy group having one or more substituents which may be the same or different and are selected from halogen atoms, cyano group, nitro group, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkyl groups, halo(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkyl groups, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkoxy groups, halo(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkoxy groups, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkylthio groups, halo(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkylthio groups, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkylsulfinyl groups, halo(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkylsulfinyl groups, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkylsulfonyl groups and halo(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkylsulfonyl groups, two adjacent Ys on the aromatic ring being able to be taken together to represent a fused ring that may have one or more substituents which may be the same or different and are selected from halogen atoms, nitro group, cyano group, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkyl groups, halo(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkyl groups, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkoxy groups, halo(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkoxy groups, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkylthio groups, halo(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkylthio groups, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkylsulfinyl groups, halo(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkylsulfinyl groups, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkylsulfonyl groups, mono(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkylamino groups, mono(halo(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkyl)amino groups, di(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkylamino groups whose (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkyl groups may be the same or different, and di(halo(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkyl)amino groups whose halo(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkyl groups may be the same or different, and n is an integer of 0 to 3.

3. A sulfonamide derivative or a salt thereof according to claim 1, wherein A is a (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkylene group or a substituted (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkylene group having one or more substituents which may be the same or different and are selected from halogen atoms, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkoxy groups, halo(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkoxy groups, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkylthio groups, halo(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkylthio groups, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkylsulfinyl groups, halo(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkylsulfinyl groups, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkylsulfonyl groups and halo(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkylsulfonyl groups, any carbon atom in the (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkylene group or substituted (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkylene group may be substituted by a (C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>)alkylene group so as to form a (C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>)cycloalkane ring, and any two carbon atoms in the (C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>)alkylene group or substituted (C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>)alkylene group may be taken together with an alkylene group so as to represent a (C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>)cycloalkane ring;

R<sup>1</sup> is a hydrogen atom; a (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkyl group; a substituted (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkyl group having one or more substituents which may be the same or different and are selected from halogen atoms, cyano group, nitro group, hydroxyl group, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkoxy groups, halo(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkoxy groups, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkylthio groups, halo(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkylthio groups, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkylsulfinyl groups, halo(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkylsulfinyl groups, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkylsulfonyl groups, halo(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkylsulfonyl groups, mono(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkylamino groups, mono(halo(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkyl)amino groups, di(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkylamino groups whose (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkyl groups may be the same or different, di(halo(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkyl)amino groups whose halo(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)

alkyl groups may be the same or different, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkoxycarbonyl groups, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkylaminocarbonyl groups, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkylcarbonyloxy groups, phenoxy group, substituted phenoxy groups having one or more substituents which may be the same or different and are selected from halogen atoms, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkyl groups, halo(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkyl groups, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkoxy groups, halo(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkoxy groups, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkylthio groups, halo(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkylthio groups, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkylsulfinyl groups, halo(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkylsulfinyl groups, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkylsulfonyl groups, halo(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkylsulfonyl groups and (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkoxycarbonyl groups, phenylthio group, substituted phenylthio groups having one or more substituents which may be the same or different and are selected from halogen atoms, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkyl groups, halo(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkyl groups, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkoxy groups, halo(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkoxy groups, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkylthio groups, halo(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkylthio groups, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkylsulfinyl groups, halo(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkylsulfinyl groups, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkylsulfonyl groups, halo(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkylsulfonyl groups and (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkoxycarbonyl groups, phenyl group, substituted phenyl groups having one or more substituents which may be the same or different and are selected from halogen atoms, cyano group, nitro group, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkyl groups, halo(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkyl groups, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkoxy groups, halo(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkoxy groups, mono(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkylamino groups, di(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkylamino groups whose (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkyl groups may be the same or different, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkylthio groups, halo(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkylthio groups, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkylsulfinyl groups, halo(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkylsulfinyl groups, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkylsulfonyl groups, halo(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkylsulfonyl groups and (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkoxycarbonyl groups, pyridyl group, and substituted pyridyl groups having one or more substituents which may be the same or different and are selected from halogen atoms, cyano group, nitro group, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkyl groups, halo(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkyl groups, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkoxy groups, halo(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkoxy groups, mono(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkylamino groups, di(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkylamino groups whose (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkyl groups may be the same or different, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkylthio groups, halo(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkylthio groups, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkylsulfinyl groups, halo(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkylsulfinyl groups, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkylsulfonyl groups, halo(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkylsulfonyl groups and (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkoxycarbonyl groups; a (C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>)alkenyl group; a halo(C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>)alkenyl group; a (C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>)alkynyl group; a halo(C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>)alkynyl group; a (C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>)cycloalkyl group; a hydroxyl group; a (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkoxy group; a halo(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkoxy group; an amino group; a mono(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkylamino group; a mono(halo(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkyl) amino group; a di(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkylamino group whose (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkyl groups may be the same or different; a di(halo(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkyl)amino group whose halo(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkyl groups may be the same or different; a (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkylcarbonylamino group; a phenylamino group; a substituted phenylamino group having on the ring one or more substituents which may be the same or different and are selected from halogen atoms, cyano group, nitro group, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkyl groups, halo(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkyl groups, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkoxy groups, halo(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkoxy groups, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkylthio groups, halo(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkylthio groups, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkylsulfinyl groups, halo(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkylsulfinyl groups, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkylsulfonyl groups, halo(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkylsulfonyl groups, mono(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkylamino groups, mono(halo(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkyl)amino groups, di(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkylamino groups whose (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkyl groups may be the same or different, di(halo(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkyl)amino groups whose halo(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkyl groups may be the same or different, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkoxycarbonyl groups and (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkylaminocarbonyl groups; a benzoylamino group; a substituted benzoylamino group having on the ring one or more substituents which may be the same or different and are selected from halogen atoms, cyano group, nitro group, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkyl groups, halo(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkyl groups, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkoxy groups, halo(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkoxy groups, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkylthio groups, halo(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkylthio groups, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkylsulfinyl groups, halo(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkylsulfinyl groups, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkylsulfonyl groups, halo(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkylsulfonyl groups, mono(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkylamino groups, mono(halo(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkyl) amino groups, di(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkylamino groups whose (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkyl groups may be the same or different, di(halo(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkyl)amino groups whose halo(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkyl groups may be the same or different, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkoxycarbonyl groups and (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkylaminocarbonyl groups; a phenyl group; a substituted phenyl group having one or more substituents which may be the same or different and are selected from halogen atoms, cyano group, nitro group, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkyl groups, halo(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkyl groups, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkoxy groups, halo(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkoxy groups, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkylthio groups, halo(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkylthio groups, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkylsulfinyl groups, halo(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkylsulfinyl groups, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkylsulfonyl groups, halo(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkylsulfonyl groups, mono(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkylamino groups, mono(halo(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkyl) amino groups, di(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkylamino groups whose (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkyl groups may be the same or different, di(halo(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkyl)amino groups whose halo(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkyl groups may be the same or different, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkoxycarbonyl groups and (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkylaminocarbonyl groups; a pyridyl group; or a substituted pyridyl group having one or more substituents which may be the same or different and are selected from halogen atoms, cyano group, nitro group, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkyl groups, halo(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkyl groups, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkoxy groups, halo(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkoxy groups, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkylthio groups, halo(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkylthio groups, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkylsulfinyl groups, halo(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkylsulfinyl groups, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkylsulfonyl groups, halo(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkylsulfonyl groups, mono(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkylamino groups, mono(halo(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkyl)amino groups, di(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkylamino groups whose (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkyl groups may be the same or different, di(halo(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkyl)amino groups whose halo(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkyl groups may be the same or different, and (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkoxycarbonyl groups;

each of R<sup>2</sup>, R<sup>3</sup> and R<sup>4</sup>, which may be the same or different, is a hydrogen atom, a (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkyl group, a (C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>)alkenyl group, a (C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>)alkynyl group, a (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)alkoxy(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)alkyl group or a (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)alkylthio(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)alkyl group, R<sup>2</sup> being able to bind to A or R<sup>1</sup> to form a 3- to 8-membered ring which may contain one to three atoms that may be the same or different and are selected from oxygen atom, sulfur atom and nitrogen atom, and which ring may have one or more substituents that may be the same or different and are selected from halogen atoms,



(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkyl groups and (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkoxy groups;

Q is a carbon atom or a nitrogen atom;

each of Xs, which may be the same or different, is a halogen atom, a nitro group, a (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkyl group, a halo(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkyl group, a (C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>)alkenyl group, a halo(C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>)alkenyl group, a (C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>)alkynyl group, a halo(C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>)alkynyl group, a (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkoxy group, a halo(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkoxy group, a (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkylcarbonyloxy group, a halo(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkylcarbonyloxy group, a (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkylthio group, a halo(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkylthio group, a (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkylsulfinyl group, a halo(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkylsulfinyl group, a (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkylsulfonyl group, a halo(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkylsulfonyl group, a (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkylsulfonyloxy group or a halo(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkylsulfonyloxy group, two adjacent Xs on the aromatic ring being able to be taken together to represent a fused ring that may have one or more substituents which may be the same or different and are selected from halogen atoms, nitro group, cyano group, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkyl groups, halo(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkyl groups, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkoxy groups, halo(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkoxy groups, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkylthio groups, halo(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkylthio groups, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkylsulfinyl groups, halo(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkylsulfinyl groups, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkylsulfonyl groups and halo(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkylsulfonyl groups, m is an integer of 0 to 2;

each of Ys, which may be the same or different, is a halogen atom; a (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkyl group; a halo(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkoxy (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkyl group; a halo(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkyl group; a hydroxyhalo(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkyl group; a (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkoxyhalo(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkyl group; a halo(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkoxyhalo(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkyl group; a (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkoxy group; a halo(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkoxy group; a halo(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkoxyhalo(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkoxy group; a (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkylthio group; a halo(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkylthio group; a (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkylsulfinyl group; a halo(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkylsulfinyl group; a (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkylsulfonyl group; a halo(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkylsulfonyl group; a halo(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkoxyhalo(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkylthio group; a halo(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkoxyhalo(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkylsulfinyl group; a halo(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkoxyhalo(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkylsulfonyl group; a phenoxy group; a substituted phenoxy group having one or more substituents which may be the same or different and are selected from halogen atoms, cyano group, nitro group, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkyl groups, halo(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkyl groups, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkoxy groups, halo(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkoxy groups, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkylthio groups, halo(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkylthio groups, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkylsulfinyl groups, halo(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkylsulfinyl groups, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkylsulfonyl groups and halo(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkylsulfonyl groups; a phenylthio group; a substituted phenylthio group having one or more substituents which may be the same or different and are selected from halogen atoms, cyano group, nitro group, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkyl groups, halo(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkyl groups, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkoxy groups, halo(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkoxy groups, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkylthio groups, halo(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkylthio groups, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkylsulfinyl groups, halo(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkylsulfinyl groups, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkylsulfonyl groups and halo(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkylsulfonyl groups; a pyridyloxy group; or a substituted pyridyloxy group having one or more substituents which may be the same or different and are selected from halogen atoms, cyano group, nitro group, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkyl groups, halo(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkyl groups, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkoxy groups, halo(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkoxy groups, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkylthio groups, halo(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkylthio groups, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkylsulfinyl groups, halo(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkylsulfinyl groups, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkylsulfonyl groups and halo(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkylsulfonyl groups, two adjacent Ys on the aromatic ring being able to be taken together to represent a fused ring that may have one or more substituents which may be the same or different and are selected from halogen atoms, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkyl groups, halo(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkyl groups, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkoxy groups, halo(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkoxy groups, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkylthio groups, halo(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkylthio groups, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkylsulfinyl groups, halo(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkylsulfinyl groups, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkylsulfonyl groups and halo(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkylsulfonyl groups, and n is an integer of 0 to 3.

4. An agricultural and horticultural insecticide **characterized by** containing a sulfonamide derivative of general formula (I) or a salt thereof according to claims 1 to 3 as an active ingredient.
5. A method for applying an agricultural and horticultural insecticide, **characterized by** treating a crop plant to be protected, soil or a paddy field with an effective amount of an agricultural and horticultural insecticide according to claim 4 in order to protect useful plants against insect pests.



## INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International application No.

PCT/JP03/10774

## A. CLASSIFICATION OF SUBJECT MATTER

Int.Cl.<sup>7</sup> C07C311/46, 311/48, 311/49, 311/50, 317/28, 323/49,  
C07D213/75, 213/42, 279/12, A01N41/06, 43/40, 47/02

According to International Patent Classification (IPC) or to both national classification and IPC

## B. FIELDS SEARCHED

Minimum documentation searched (classification system followed by classification symbols)

Int.Cl.<sup>7</sup> C07C311/46, 311/48, 311/49, 311/50, 317/28, 323/49,  
C07D213/75, 213/42, 279/12, A01N41/06, 43/40, 47/02

Documentation searched other than minimum documentation to the extent that such documents are included in the fields searched

Electronic data base consulted during the international search (name of data base and, where practicable, search terms used)

REGISTRY (STN), CA (STN)

## C. DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT

Category*	Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages	Relevant to claim No.
P, X	WO 03/11028 A1 (Nissan Chemical Industries, Ltd.), 13 February, 2003 (13.02.03), (Family: none)	1-5
P, X	WO 02/94766 A1 (Nihon Nohyaku Co., Ltd.), 28 November, 2002 (28.11.02), & JP 2003-34672 A	1-5
X	WO 01/46124 A1 (Nihon Nohyaku Co., Ltd.), 28 June, 2001 (28.06.01), & JP 2001-240580 A & EP 1241159 A1	1-5

☐ Further documents are listed in the continuation of Box C.☐ See patent family annex.

\* Special categories of cited documents:

"A" document defining the general state of the art which is not considered to be of particular relevance

"E" earlier document but published on or after the international filing date

"I" document which may throw doubts on priority claim(s) or which is cited to establish the publication date of another citation or other special reason (as specified)

"O" document referring to an oral disclosure, use, exhibition or other means

"P" document published prior to the international filing date but later than the priority date claimed

"T" later document published after the international filing date or priority date and not in conflict with the application but cited to understand the principle or theory underlying the invention

"X" document of particular relevance; the claimed invention cannot be considered novel or cannot be considered to involve an inventive step when the document is taken alone

"Y" document of particular relevance; the claimed invention cannot be considered to involve an inventive step when the document is combined with one or more other such documents, such combination being obvious to a person skilled in the art

"&amp;" document member of the same patent family

Date of the actual completion of the international search  
26 November, 2003 (26.11.03)

Date of mailing of the international search report  
16 December, 2003 (16.12.03)

Name and mailing address of the ISA/  
Japanese Patent Office

Authorized officer

Facsimile No.

Telephone No.

Form PCT/ISA/210 (second sheet) (July 1998)

(19) 世界知的所有権機関  
国際事務局



(43) 国際公開日  
2004 年 3 月 4 日 (04.03.2004)

PCT

(10) 国際公開番号  
WO 2004/018415 A1

(51) 国際特許分類<sup>7</sup>: C07C 311/46,  
311/48, 311/49, 311/50, 317/28, 323/49, C07D 213/75,  
213/42, 279/12, A01N 41/06, 43/40, 47/02

[JP/JP]; 〒586-0094 大阪府 河内長野市 小山田町345  
日本農薬株式会社 総合研究所内 Osaka (JP). 遠西 正  
範 (TOHNISHI, Masanori) [JP/JP]; 〒586-0094 大阪府  
河内長野市 小山田町345 日本農薬株式会社 総合研  
究所内 Osaka (JP).

(21) 国際出願番号: PCT/JP2003/010774

(22) 国際出願日: 2003 年 8 月 26 日 (26.08.2003)

(74) 代理人: 浅村 皓, 外 (ASAMURA, Kiyoshi et al.); 〒  
100-0004 東京都 千代田区 大手町2丁目2番1号 新大  
手町ビル331 Tokyo (JP).

(25) 国際出願の言語: 日本語

(26) 国際公開の言語: 日本語

(30) 優先権データ:  
特願2002-245264 2002 年 8 月 26 日 (26.08.2002) JP

(81) 指定国 (国内): AE, AG, AL, AM, AT, AU, AZ, BA, BB,  
BG, BR, BY, BZ, CA, CH, CN, CO, CR, CU, CZ, DE, DK,  
DM, DZ, EC, EE, ES, FI, GB, GD, GE, GH, GM, HR, HU,  
ID, IL, IN, IS, KE, KG, KR, KZ, LC, LK, LR, LS, LT, LU,  
LV, MA, MD, MG, MK, MN, MW, MX, MZ, NI, NO, NZ,  
OM, PG, PH, PL, PT, RO, RU, SC, SD, SE, SG, SK, SL,  
SY, TJ, TM, TN, TR, TT, TZ, UA, UG, US, UZ, VC, VN,  
YU, ZA, ZM, ZW.

(71) 出願人 (米国を除く全ての指定国について): 日本農  
薬株式会社 (NIHON NOHYAKU CO., LTD.) [JP/JP];  
〒103-8236 東京都 中央区 日本橋1丁目2番5号 Tokyo  
(JP).

(84) 指定国 (広域): ARIPO 特許 (GH, GM, KE, LS, MW, MZ,  
SD, SL, SZ, TZ, UG, ZM, ZW), ユーラシア特許 (AM,  
AZ, BY, KG, KZ, MD, RU, TJ, TM), ヨーロッパ特許  
(AT, BE, BG, CH, CY, CZ, DE, DK, EE, ES, FI, FR, GB,  
GR, HU, IE, IT, LU, MC, NL, PT, RO, SE, SI, SK, TR),  
OAPI 特許 (BF, BJ, CF, CG, CI, CM, GA, GN, GQ, GW,  
ML, MR, NE, SN, TD, TG).

(72) 発明者; および

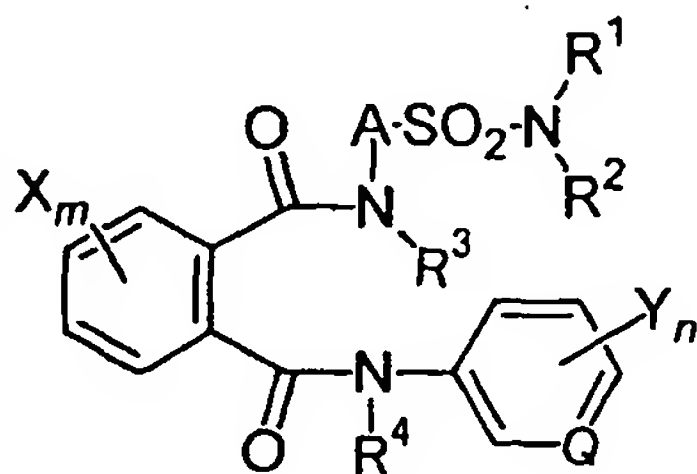
(75) 発明者/出願人 (米国についてのみ): 山口 実 (YAM-  
AGUCHI, Minoru) [JP/JP]; 〒586-0094 大阪府 河内長野  
市 小山田町345 日本農薬株式会社 総合研究所内 Osaka  
(JP). 中尾 勇美 (NAKAO, Hayami) [JP/JP]; 〒586-0094  
大阪府 河内長野市 小山田町345 日本農薬株式会  
社 総合研究所内 Osaka (JP). 後藤 誠 (GOTO, Makoto)  
[JP/JP]; 〒586-0094 大阪府 河内長野市 小山田町345  
日本農薬株式会社 総合研究所内 Osaka (JP). 森本 雅  
之 (MORIMOTO, Masayuki) [JP/JP]; 〒586-0094 大阪  
府 河内長野市 小山田町345 日本農薬株式会社 総合  
研究所内 Osaka (JP). 藤岡 伸祐 (FUJIOKA, Shinsuke)

添付公開書類:  
— 国際調査報告書

2 文字コード及び他の略語については、定期発行される  
各PCTガゼットの巻頭に掲載されている「コードと略語  
のガイダンスノート」を参照。

(54) Title: SULFONAMIDE DERIVATIVES, INSECTICIDES FOR AGRICULTURAL AND HORTICULTURAL USE, AND  
USAGE THEREOF

(54) 発明の名称: スルホンアミド誘導体及び農園芸用殺虫剤並びにその使用方法



(I)

(57) Abstract: Sulfonamide derivatives represented by the general  
formula (1) or salts thereof; insecticides for agricultural and horti-  
cultural use containing the same as the active ingredient; and us-  
age thereof: (1) [wherein A is optionally substituted C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> alkylene,  
C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub> alkenylene, or the like; R<sup>1</sup> is H, optionally substituted C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>  
alkyl, C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub> alkenyl, C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub> cycloalkyl, or the like; R<sup>2</sup>, R<sup>3</sup>, and R<sup>4</sup> are  
each H, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> alkyl, C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub> alkenyl, or the like, or R<sup>2</sup> and A or R<sup>2</sup>  
and R<sup>1</sup> may form a three- to eight-membered ring which may be in-  
terrupted by one to three atoms selected from among O, S, and N; Q  
is C or N; X and Y are each halogeno, CN, NO<sub>2</sub>, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> alkyl, C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>

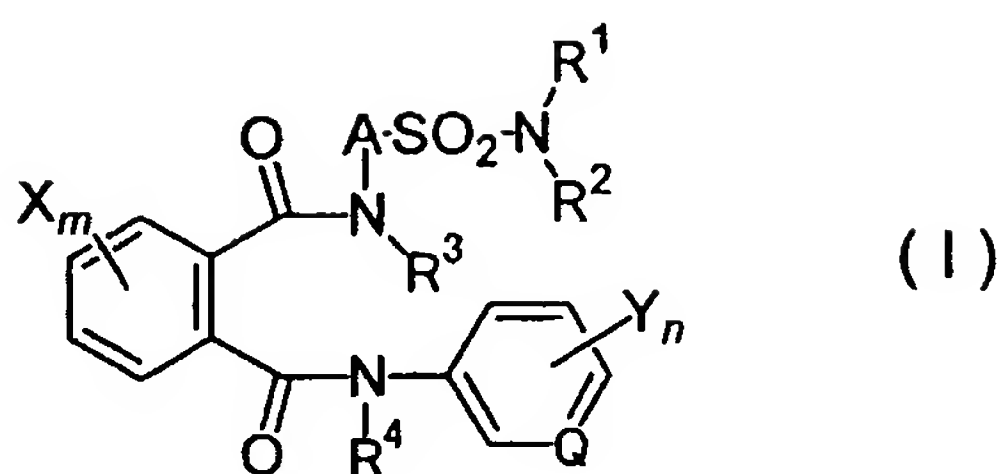
alkenyl, or the like; m is 0 to 2; n is 0 to 3; and two adjacent Xs or Ys on the aromatic ring may be united to form a fused ring]. The  
compounds exhibit excellent insecticidal activity against pest insects resistant to existing pesticides even when applied in dosages  
lower than those of similar pesticides.

[続葉有]



(57) 要約:

一般式 (I)



{式中、Aは置換されていてもよいC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキレン、C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>アルケニレン等を示し；R<sup>1</sup>はH、置換されていてもよいC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキル、C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>アルケニル、C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>シクロアルキル等を示し；R<sup>2</sup>、R<sup>3</sup>、R<sup>4</sup>はH、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキル、C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>アルケニル等を示し、又、R<sup>2</sup>とA又はR<sup>2</sup>とR<sup>1</sup>は1～3個のO、S、Nで中断されても良い3～8員環等を形成することができる；QはC又はN；X、Yはハロゲン、CN、NO<sub>2</sub>、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキル、C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>アルケニル等；mは0～2；nは0～3を示し；芳香環上の隣接した2個のX又は2個のYは一緒になって縮合環を形成することもできる。}のスルホンアミド誘導体又はその塩及び該化合物を有効成分とする農園芸用殺虫剤並びにその使用方法を提供する。本発明の化合物は、既存農薬に対する抵抗性害虫について、類似の農薬に比して低薬量で優れた殺虫作用を示す。

## 明 細 書

## スルホンアミド誘導体及び農園芸用殺虫剤並びにその使用方法

## 5 技術分野

本発明はスルホンアミド誘導体又はその塩類及び該化合物を有効成分として含有する農園芸用殺虫剤並びにその使用方法に関するものである。

## 背景技術

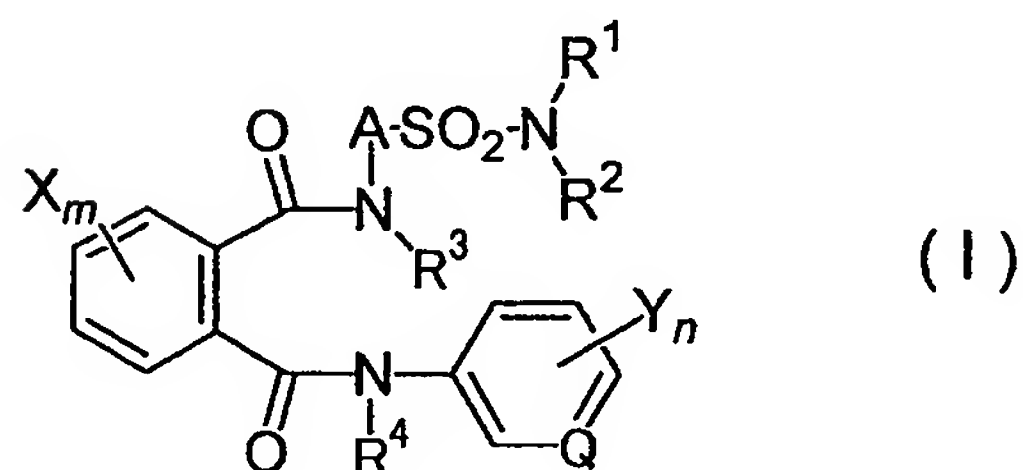
従来、本発明のスルホンアミド誘導体に類似した化合物が農園芸用殺虫剤として有用であることが知られている（例えば、特開平 1 1 - 2 4 0 8 5 7 号公報又は特開 2 0 0 1 - 1 3 1 1 4 1 号公報参照。）。しかしながら、本発明の一般式（I）で表される化合物についての実施例、物性等は示されていない。

農業及び園芸等の作物生産において、害虫等による被害は今なお大きく、既存薬に対する抵抗性害虫の発生等の要因から新規な農園芸用殺虫剤の開発が望まれている。又、就農者の高齢化等により各種の省力的施用方法が求められるとともに、これらの施用方法に適した性格を有する農園芸用殺虫剤の創出が求められている。

## 発明の開示

本発明者等は新規な農園芸用殺虫剤を開発すべく鋭意研究を重ねた結果、本発明の一般式（I）で表されるスルホンアミド誘導体又はその塩類が文献未記載の新規化合物であり、上記従来文献に記載される類似の化合物に対し、低薬量で効果を示す優れた農園芸用殺虫剤であることを見出し、本発明を完成させたものである。

即ち、本発明は、一般式（I）





- {式中、AはC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキレン基、同一又は異なっても良く、ハロゲン原子、シアノ基、ニトロ基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルコキシ基、ハロC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルコキシ基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルチオ基、ハロC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルチオ基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルスルフィニル基、ハロC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルスルフィニル基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルスルホニル基、ハロC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルスルホニル基、モノC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルアミノ基又は同一若しくは異なっても良いジC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルアミノ基から選択される1以上の置換基を有する置換C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキレン基、C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>アルケニレン基、同一又は異なっても良く、ハロゲン原子、シアノ基、ニトロ基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルコキシ基、ハロC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルコキシ基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルチオ基、ハロC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルチオ基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルスルフィニル基、ハロC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルスルフィニル基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルスルホニル基、ハロC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルスルホニル基、モノC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルアミノ基又は同一若しくは異なっても良いジC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルアミノ基から選択される1以上の置換基を有する置換C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>アルケニレン基、C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>アルキニレン基又は同一若しくは異なっても良く、ハロゲン原子、シアノ基、ニトロ基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルコキシ基、ハロC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルコキシ基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルチオ基、ハロC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルチオ基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルスルフィニル基、ハロC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルスルフィニル基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルスルホニル基、ハロC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルスルホニル基、モノC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルアミノ基又は同一若しくは異なっても良いジC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルアミノ基から選択される1以上の置換基を有する置換C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>アルキニレン基を示す。又、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキレン基、置換C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキレン基、C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>アルケニレン基、置換C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>アルケニレン基、C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>アルキニレン基又は置換C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>アルキニレン基中の任意の飽和炭素原子はC<sub>2</sub>-C<sub>5</sub>アルキレン基で置換されてC<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>シクロアルカン環を示すこともでき、C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>アルキレン基、置換C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>アルキレン基、C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>アルケニレン基又は置換C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>アルケニレン基中の任意の2個の炭素原子はアルキレン基又はアルケニレン基と一緒にあってC<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>シクロアルカン環又はC<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>シクロアルケン環を示すこともできる。

R<sup>1</sup>は水素原子、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキル基、同一又は異なっても良く、ハロゲン原子、シアノ基、ニトロ基、水酸基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルコキシ基、ハロC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルコキシ基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルチオ基、ハロC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルチオ基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルスルフィニル基、ハロC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルスルフィニル基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルスルホニル基、ハロC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アル

- キルスルホニル基、モノC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルアミノ基、モノ（ハロC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキル）アミノ基、同一又は異なっても良いジC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルアミノ基、同一又は異なっても良いジ（ハロC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキル）アミノ基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルコキシカルボニル基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルアミノカルボニル基、（C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>）アルキルカルボニルオキシ基、フェノキシ基、同一又は異なっても良く、ハロゲン原子、（C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>）アルキル基、ハロ（C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>）アルキル基、（C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>）アルコキシ基、ハロ（C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>）アルコキシ基、（C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>）アルキルチオ基、ハロ（C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>）アルキルチオ基、（C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>）アルキルスルフィニル基、ハロ（C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>）アルキルスルフィニル基、（C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>）アルキルスルホニル基、ハロ（C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>）アルキルスルホニル基又は（C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>）アルコキシカルボニル基から選択される1以上の置換基を有するフェノキシ基、フェニルチオ基、同一又は異なっても良く、ハロゲン原子、（C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>）アルキル基、ハロ（C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>）アルキル基、（C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>）アルコキシ基、ハロ（C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>）アルコキシ基、（C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>）アルキルチオ基、ハロ（C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>）アルキルチオ基、（C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>）アルキルスルフィニル基、ハロ（C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>）アルキルスルフィニル基、（C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>）アルキルスルホニル基、ハロ（C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>）アルキルスルホニル基又は（C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>）アルコキシカルボニル基から選択される1以上の置換基を有するフェニルチオ基、フェニル基、同一又は異なっても良く、ハロゲン原子、シアノ基、ニトロ基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキル基、ハロC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキル基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルコキシ基、ハロC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルコキシ基、モノC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルアミノ基、同一又は異なっても良いジC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルアミノ基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルチオ基、ハロC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルチオ基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルスルフィニル基、ハロC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルスルフィニル基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルスルホニル基、ハロC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルスルホニル基又はC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルコキシカルボニル基から選択される1以上の置換基を有する置換フェニル基、ピリジル基又は同一若しくは異なっても良く、ハロゲン原子、シアノ基、ニトロ基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキル基、ハロC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキル基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルコキシ基、ハロC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルコキシ基、モノC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルアミノ基、同一又は異なっても良いジC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルアミノ基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルチオ基、ハロC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルチオ基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルスルフィニル基、ハロC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルスルフィニル基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルスルホニル基、ハロC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルスルホニル基又はC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルコキシカルボニル基から選択される1以上の置換基を有する置換ピリジル基から選択される1以

- 上の置換基を有する置換 $C_1-C_6$ アルキル基、 $C_3-C_6$ アルケニル基、ハロ $C_3-C_6$ アルケニル基、 $C_3-C_6$ アルキニル基、ハロ $C_3-C_6$ アルキニル基、 $C_3-C_6$ シクロアルキル基、水酸基、 $C_1-C_6$ アルコキシ基、ハロ $C_1-C_6$ アルコキシ基、アミノ基、モノ $C_1-C_6$ アルキルアミノ基、モノ（ハロ $C_1-C_6$ アルキル）アミノ基、同一又は異なっても良い
- 5 ジ $C_1-C_6$ アルキルアミノ基、同一又は異なっても良いジ（ハロ $C_1-C_6$ アルキル）アミノ基、 $C_1-C_6$ アルキルカルボニルアミノ基、フェニルアミノ基、同一又は異なっても良く、ハロゲン原子、シアノ基、ニトロ基、 $C_1-C_6$ アルキル基、ハロ $C_1-C_6$ アルキル基、 $C_1-C_6$ アルコキシ基、ハロ $C_1-C_6$ アルコキシ基、 $C_1-C_6$ アルキルチオ基、ハロ $C_1-C_6$ アルキルチオ基、 $C_1-C_6$ アルキルスルフィニル基、ハロ $C_1-C_6$ アルキルス
- 10 ルフィニル基、 $C_1-C_6$ アルキルスルホニル基、ハロ $C_1-C_6$ アルキルスルホニル基、モノ $C_1-C_6$ アルキルアミノ基、モノ（ハロ $C_1-C_6$ アルキル）アミノ基、同一又は異なっても良いジ $C_1-C_6$ アルキルアミノ基、同一又は異なっても良いジ（ハロ $C_1-C_6$ アルキル）アミノ基、 $C_1-C_6$ アルコキシカルボニル基又は $C_1-C_6$ アルキルアミノカルボニル基から選択される1以上の置換基を環上に有する置換フェニルアミノ基、
- 15 ベンゾイルアミノ基、同一又は異なっても良く、ハロゲン原子、シアノ基、ニトロ基、 $C_1-C_6$ アルキル基、ハロ $C_1-C_6$ アルキル基、 $C_1-C_6$ アルコキシ基、ハロ $C_1-C_6$ アルコキシ基、 $C_1-C_6$ アルキルチオ基、ハロ $C_1-C_6$ アルキルチオ基、 $C_1-C_6$ アルキルスルフィニル基、ハロ $C_1-C_6$ アルキルスルフィニル基、 $C_1-C_6$ アルキルスルホニル基、ハロ $C_1-C_6$ アルキルスルホニル基、モノ $C_1-C_6$ アルキルアミノ基、モノ（ハロ
- 20  $C_1-C_6$ アルキル）アミノ基、同一又は異なっても良いジ $C_1-C_6$ アルキルアミノ基、同一又は異なっても良いジ（ハロ $C_1-C_6$ アルキル）アミノ基、 $C_1-C_6$ アルコキシカルボニル基又は $C_1-C_6$ アルキルアミノカルボニル基から選択される1以上の置換基を環上に有する置換ベンゾイルアミノ基、 $-N=C(T^1)T^2$ （式中、 $T^1$ 及び $T^2$ は同一又は異なっても良く、水素原子、 $C_1-C_6$ アルキル基、ハロ $C_1-C_6$ アルキ
- 25 ル基、フェニル基又は同一若しくは異なっても良く、ハロゲン原子、シアノ基、ニトロ基、 $C_1-C_6$ アルキル基、ハロ $C_1-C_6$ アルキル基、 $C_1-C_6$ アルコキシ基、ハロ $C_1-C_6$ アルコキシ基、 $C_1-C_6$ アルキルチオ基、ハロ $C_1-C_6$ アルキルチオ基、 $C_1-C_6$ アルキルスルフィニル基、ハロ $C_1-C_6$ アルキルスルフィニル基、 $C_1-C_6$ アルキルスルホニル基、ハロ $C_1-C_6$ アルキルスルホニル基、モノ $C_1-C_6$ アルキルアミノ基、モノ

- (ハロC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキル) アミノ基、同一又は異なっても良いジC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルアミノ基、同一又は異なっても良いジ (ハロC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキル) アミノ基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルコキシカルボニル基又はC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルアミノカルボニル基から選択される1以上の置換基を有する置換フェニル基を示す。)、フェニル基、同一又は異なっても
- 5 良く、ハロゲン原子、シアノ基、ニトロ基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキル基、ハロC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキル基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルコキシ基、ハロC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルコキシ基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルチオ基、ハロC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルチオ基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルスルフィニル基、ハロC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルスルフィニル基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルスルホニル基、ハロC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルスルホニル基、モノC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルアミノ基、モノ (ハロC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキル) アミノ基、同一又は異なっ
- 10 ても良いジC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルアミノ基、同一又は異なっても良いジ (ハロC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキル) アミノ基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルコキシカルボニル基又はC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルアミノカルボニル基から選択される1以上の置換基を有する置換フェニル基、ピリジル基又は同一若しくは異なっても良く、ハロゲン原子、シアノ基、ニトロ基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキル基、ハロC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキル基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルコキシ基、ハロC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルコキシ基、
- 15 C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルチオ基、ハロC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルチオ基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルスルフィニル基、ハロC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルスルフィニル基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルスルホニル基、ハロC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルスルホニル基、モノC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルアミノ基、モノ (ハロC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキル) アミノ基、同一又は異なっても良いジC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルアミノ基、同一又は異なっても良いジ (ハロC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキル) アミノ基又はC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルコキシカルボニル基から
- 20 選択される1以上の置換基を有する置換ピリジル基を示す。

R<sup>2</sup>、R<sup>3</sup>及びR<sup>4</sup>は同一又は異なっても良く、水素原子、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキル基、C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>アルケニル基、C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>アルキニル基、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>アルコキシC<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>アルキル基又はC<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>アルキルチオC<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>アルキル基を示す。又、R<sup>2</sup>はA又はR<sup>1</sup>と結合して、1～3個の同一又は異なっても良い酸素原子、硫黄原子又は窒素原子により中断されて

25 も良い3～8員環を形成することができ、該3～8員環は同一又は異なっても良く、ハロゲン原子、(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>) アルキル基、(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>) アルコキシ基から選択される1以上の置換基を有することもできる。又、R<sup>2</sup>はR<sup>1</sup>と一緒になって=C

(T<sup>3</sup>) T<sup>4</sup> (式中、T<sup>3</sup>及びT<sup>4</sup>は同一又は異なっても良く、水素原子、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキル基、ハロC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキル基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルコキシ基、ハロC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルコキシ基、ア



- ミノ基、モノC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルアミノ基、同一又は異なっても良いジC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルアミノ基、モノ（ハロC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキル）アミノ基、同一又は異なっても良いジ（ハロC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキル）アミノ基、フェニル基又は同一若しくは異なっても良く、ハロゲン原子、シアノ基、ニトロ基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキル基、ハロC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキル基、
- 5 C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルコキシ基、ハロC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルコキシ基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルチオ基、ハロC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルチオ基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルスルフィニル基、ハロC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルスルフィニル基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルスルホニル基、ハロC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルスルホニル基、モノC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルアミノ基、モノ（ハロC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキル）アミノ基、同一又は異なっても良いジC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルアミノ基、同一又は異なっても良いジ（ハロC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキル）アミノ基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルコキシカルボニル基又はC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルアミノカルボニル基から選択される1以上の置換基を有する置換フェニル基を示す。）を示すことができる。

Qは炭素原子又は窒素原子を示す。

- Xは同一又は異なっても良く、ハロゲン原子、シアノ基、ニトロ基、アミノ基、
- 15 C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキル基、ハロC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキル基、C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>アルケニル基、ハロC<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>アルケニル基、C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>アルキニル基、ハロC<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>アルキニル基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルコキシ基、ハロC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルコキシ基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルカルボニルオキシ基、ハロC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルカルボニルオキシ基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルチオ基、ハロC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルチオ基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルスルフィニル基、ハロC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルスルフィニル基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルスルホニル基、ハロC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルスルホニル基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルスルホニルオキシ基、ハロC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルスルホニルオキシ基、モノC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルアミノ基、モノ（ハロC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキル）アミノ基、同一又は異なっても良いジC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルアミノ基、同一又は異なっても良いジ（ハロC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキル）アミノ基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルカルボニルアミノ基、ハロC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルカルボニルアミノ基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルスルホニルアミノ基又はハロC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルスルホニルアミノ基を示す。
- 20
- 25

又、芳香環上の隣接した2個のXは一緒になって縮合環を形成することができ、該縮合環は同一又は異なっても良く、ハロゲン原子、ニトロ基、シアノ基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキル基、ハロC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキル基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルコキシ基、ハロC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルコキシ基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルチオ基、ハロC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルチオ基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルスルフィニ

ル基、ハロC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルスルフィニル基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルスルホニル基、ハロC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルスルホニル基、モノC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルアミノ基、モノ（ハロC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキル）アミノ基、同一又は異なっても良いジC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルアミノ基又は同一若しくは異なっても良いジ（ハロC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキル）アミノ基から選択される1以上の置換基を有することもできる。mは0～2の整数を示す。

Yは同一又は異なっても良く、ハロゲン原子、シアノ基、ニトロ基、水酸基、ホルミル基、 $C_1-C_6$ アルキル基、ヒドロキシ $C_1-C_6$ アルキル基、 $C_1-C_6$ アルコキシ $C_1-C_6$ アルキル基、ハロ $C_1-C_6$ アルコキシ $C_1-C_6$ アルキル基、ハロ $C_1-C_6$ アルキル基、ヒドロキシハロ $C_1-C_6$ アルキル基、 $C_1-C_6$ アルコキシハロ $C_1-C_6$ アルキル基、ハロ $C_1-C_6$ アルコキシハロ $C_1-C_6$ アルキル基、 $C_1-C_6$ アルコキシ基、ハロ $C_1-C_6$ アルコキシ基、ハロ $C_1-C_6$ アルコキシハロ $C_1-C_6$ アルコキシ基、 $C_1-C_6$ アルキルチオ基、ハロ $C_1-C_6$ アルキルチオ基、 $C_1-C_6$ アルキルスルフィニル基、ハロ $C_1-C_6$ アルキルスルフィニル基、 $C_1-C_6$ アルキルスルホニル基、ハロ $C_1-C_6$ アルキルスルホニル基、ハロ $C_1-C_6$ アルコキシハロ $C_1-C_6$ アルキルチオ基、ハロ $C_1-C_6$ アルコキシハロ $C_1-C_6$ アルキルスルフィニル基、ハロ $C_1-C_6$ アルコキシハロ $C_1-C_6$ アルキルスルホニル基、フェノキシ基、同一又は異なっても良く、ハロゲン原子、シアノ基、ニトロ基、 $C_1-C_6$ アルキル基、ハロ $C_1-C_6$ アルキル基、 $C_1-C_6$ アルコキシ基、ハロ $C_1-C_6$ アルコキシ基、 $C_1-C_6$ アルキルチオ基、ハロ $C_1-C_6$ アルキルチオ基、 $C_1-C_6$ アルキルスルフィニル基、ハロ $C_1-C_6$ アルキルスルフィニル基、 $C_1-C_6$ アルキルスルホニル基又はハロ $C_1-C_6$ アルキルスルホニル基から選択される1以上の置換基を有する置換フェノキシ基、フェニルチオ基、同一又は異なっても良く、ハロゲン原子、シアノ基、ニトロ基、 $C_1-C_6$ アルキル基、ハロ $C_1-C_6$ アルキル基、 $C_1-C_6$ アルコキシ基、ハロ $C_1-C_6$ アルコキシ基、 $C_1-C_6$ アルキルチオ基、ハロ $C_1-C_6$ アルキルチオ基、 $C_1-C_6$ アルキルスルフィニル基、ハロ $C_1-C_6$ アルキルスルフィニル基、 $C_1-C_6$ アルキルスルホニル基又はハロ $C_1-C_6$ アルキルスルホニル基から選択される1以上の置換基を有する置換フェニルチオ基、ピリジルオキシ基又は同一若しくは異なっても良く、ハロゲン原子、シアノ基、ニトロ基、 $C_1-C_6$ アルキル基、ハロ $C_1-C_6$ アルキル基、 $C_1-C_6$ アルコキシ基、ハロ $C_1-C_6$ アルコキシ基、 $C_1-C_6$ アルキルチオ基、ハロ $C_1-C_6$ アルキルチオ基、 $C_1-C_6$ アルキルスルフィニル基、ハロ $C_1-C_6$ アルキルスルフィニル基、ハロ $C_1-C_6$ アルキルスルホニル基又はハロ $C_1-C_6$ アルキルスルホニル基から選択される1以上の置換基を有する置換ピリジルオキシ基。

イニル基、 $C_1-C_6$ アルキルスルホニル基又はハロ $C_1-C_6$ アルキルスルホニル基から選択される1以上の置換基を有する置換ピリジルオキシ基を示す。

- 又、芳香環上の隣接した2個のYは一緒になって縮合環を形成することができ、該縮合環は同一又は異なっても良く、ハロゲン原子、ニトロ基、シアノ基、 $C_1-C_6$ アルキル基、ハロ $C_1-C_6$ アルキル基、 $C_1-C_6$ アルコキシ基、ハロ $C_1-C_6$ アルコキシ基、 $C_1-C_6$ アルキルチオ基、ハロ $C_1-C_6$ アルキルチオ基、 $C_1-C_6$ アルキルスルフィニル基、ハロ $C_1-C_6$ アルキルスルフィニル基、 $C_1-C_6$ アルキルスルホニル基、ハロ $C_1-C_6$ アルキルスルホニル基、モノ $C_1-C_6$ アルキルアミノ基、モノ（ハロ $C_1-C_6$ アルキル）アミノ基、同一又は異なっても良いジ $C_1-C_6$ アルキルアミノ基又は同一若しくは異なっても良いジ（ハロ $C_1-C_6$ アルキル）アミノ基から選択される1以上の置換基を有することもできる。nは0～3の整数を示す。}

で表されるスルホンアミド誘導体又はその塩類及び該化合物を有効成分として含有する農園芸用殺虫剤並びにその使用方法に関するものである。

発明を実施するための形態

- 15 本発明のスルホンアミド誘導体の一般式（I）の定義において「ハロゲン原子」とは塩素原子、臭素原子、碘素原子又はフッ素原子を示し、「 $C_1-C_6$ アルキル」とは、例えばメチル、エチル、 $n$ -プロピル、 $i$ -プロピル、 $n$ -ブチル、 $i$ -ブチル、 $s$ -ブチル、 $t$ -ブチル、 $n$ -ペンチル、 $n$ -ヘキシル等の直鎖又は分岐鎖状の炭素原子数1～6個のアルキル基を示し、「ハロ $C_1-C_6$ アルキル」
- 20 とは、同一又は異なっても良い1以上のハロゲン原子により置換された直鎖又は分岐鎖状の炭素原子数1～6個のアルキル基を示し、「 $C_3-C_6$ シクロアルキル」とは、シクロプロピル、シクロブチル、シクロペンチル、シクロヘキシル等の炭素原子数3～6個からなる環状のアルキル基を示し、「 $C_1-C_6$ アルキレン」とはメチレン、エチレン、プロピレン、トリメチレン、ジメチルメチレン、テトラメチ
- 25 レン、イソブチレン、ジメチルエチレン等の直鎖又は分岐鎖状の炭素原子数1～6個のアルキレン基を示し、「 $C_2-C_6$ アルケニレン」とは直鎖又は分岐鎖状の炭素原子数2～6個のアルケニレン基を示し、「 $C_2-C_6$ アルキニレン」とは直鎖又は分岐鎖状の炭素原子数2～6個のアルキニレン基を示す。

「縮合環」としてはナフタレン環、テトラヒドロナフタレン環、インデン環、

インダン環、キノリン環、キナゾリン環、クロマン環、イソクロマン環、インドール環、インドリン環、ベンゾジオキサン環、ベンゾジオキソール環、ベンゾフラン環、ジヒドロベンゾフラン環、ベンゾチオフェン環、ジヒドロベンゾチオフェン環、ベンゾオキサゾール環、ベンゾチアゾール環、ベンズイミダゾール環又はインダゾール環等を例示することができる。

本発明の一般式（I）で表されるスルホンアミド誘導体の塩類としては、例えば塩酸塩、硫酸塩、硝酸塩、燐酸塩等の無機酸塩類、酢酸塩、フマル酸塩、マレイン酸塩、シュウ酸塩、メタンスルホン酸塩、ベンゼンスルホン酸塩、パラトルエンスルホン酸等の有機酸塩類、ナトリウムイオン、カリウムイオン、カルシウムイオン等との塩類を例示することができる。

本発明の一般式（I）で表されるスルホンアミド誘導体は、その構造式中に1つ又は複数個の不斉炭素原子又は不斉中心を含む場合があり、2種以上の光学異性体及びジアステレオマーが存在する場合もあり、本発明は各々の光学異性体及びそれらが任意の割合で含まれる混合物をも全て包含するものである。又、本発明の一般式（I）で表されるスルホンアミド誘導体は、その構造式中に1つ又は複数個の炭素－炭素二重結合又は炭素－窒素二重結合に由来する2種以上の幾何異性体が存在する場合もあるが、本発明は各々の幾何異性体及びそれらが任意の割合で含まれる混合物をも全て包含するものである。

本発明の一般式（I）で表されるスルホンアミド誘導体において、Aとして特に好ましくは $C_1-C_6$ アルキレン基である。 $R^1$ として好ましくは水素原子、 $C_1-C_6$ アルキル基、置換 $C_1-C_6$ アルキル基、 $C_3-C_6$ アルケニル基、 $C_3-C_6$ アルキニル基、フェニル基又は置換フェニル基であり、特に好ましくは $C_1-C_6$ アルキル基、 $C_1-C_6$ アルキルチオ $C_1-C_6$ アルキル基、 $C_1-C_6$ アルキルスルフィニル $C_1-C_6$ アルキル基又は $C_1-C_6$ アルキルスルホニル $C_1-C_6$ アルキル基である。 $R^2$ 、 $R^3$ 及び $R^4$ として好ましくは水素原子又は $C_1-C_6$ アルキル基である。Qとして好ましくは炭素原子又は窒素原子であり、特に好ましくは炭素原子である。Xとして好ましくはハロゲン原子、ニトロ基、 $C_1-C_6$ アルキル基、ハロ $C_1-C_6$ アルキル基、ハロ $C_1-C_6$ アルコキシ基、 $C_1-C_6$ アルキルカルボニルオキシ基、 $C_1-C_6$ アルキルスルホニルオキシ基又はハロ $C_1-C_6$ アルキルスルホニルオキシ基であり、特に好ましくはハロゲン原子である。

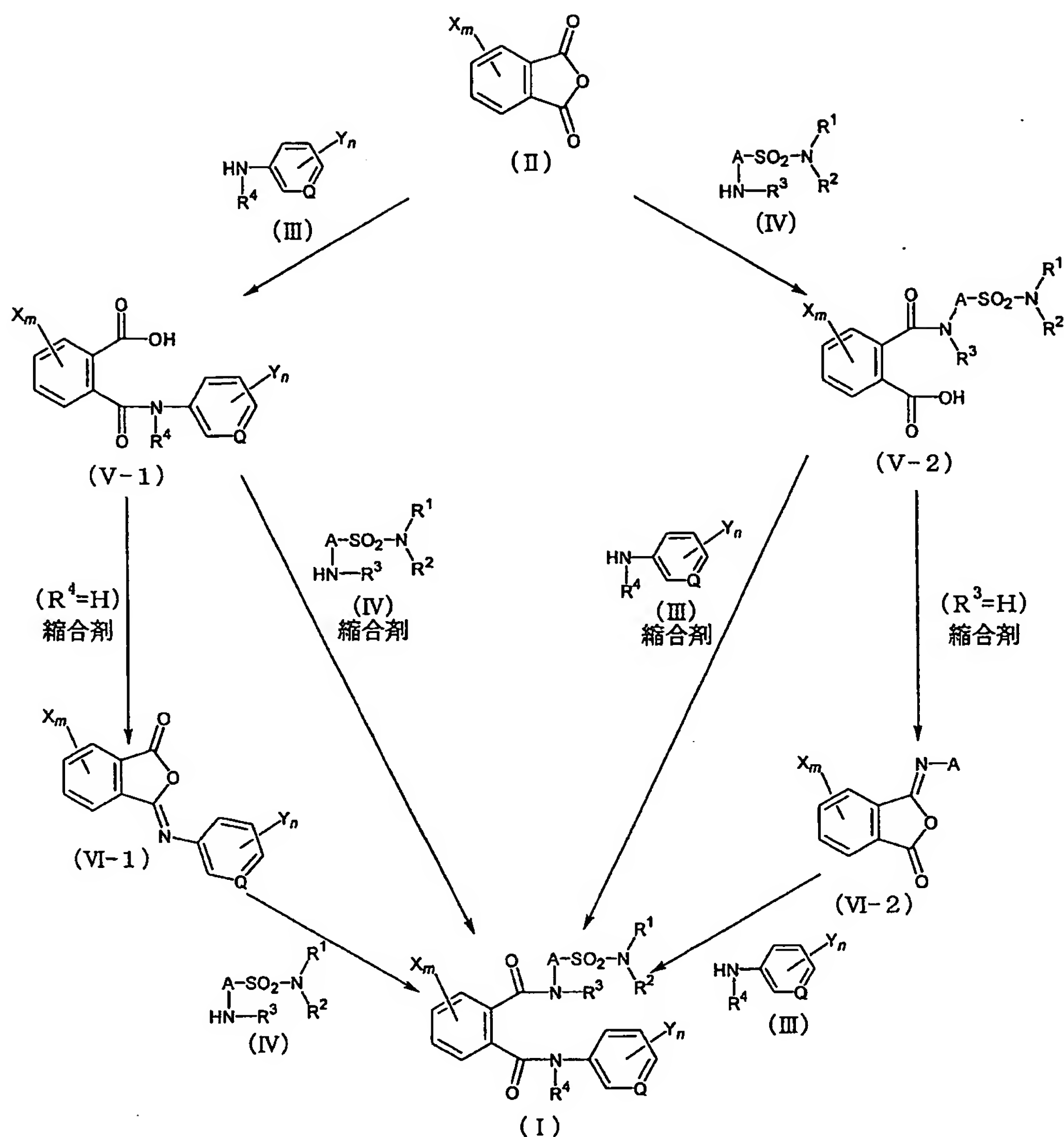


mとして好ましくは1又は2であり、特に好ましくは1である。Yとして好ましくはハロゲン原子、 $C_1-C_6$ アルキル基、ハロ $C_1-C_6$ アルコキシ $C_1-C_6$ アルキル基、ハロ $C_1-C_6$ アルキル基、ヒドロキシハロ $C_1-C_6$ アルキル基、 $C_1-C_6$ アルコキシハロ $C_1-C_6$ アルキル基、ハロ $C_1-C_6$ アルコキシハロ $C_1-C_6$ アルキル基、 $C_1-C_6$ アルコキシ基又はハロ $C_1-C_6$ アルコキシ基であり、特に好ましくは $C_1-C_6$ アルキル基又はハロ $C_1-C_6$ アルキル基である。nとして好ましくは1～3の整数であり、特に好ましくは2である。

本発明の、一般式(I)で表されるスルホンアミド誘導体は例えば、下記に図示する製造方法により製造することができるが、これらに限定されるものではない。

製造方法

11



(式中、A、 $R^1 \sim R^4$ 、X、Y、n、m及びQは前記に同じ。)

本反応は J. Med. Chem. , 10, 982 (1967)、特開平11-240857号公報、特開2001-131141号公報等の開示の方法に従い  
 5 製造することができる。即ち、一般式 (II) で表されるフタル酸無水物類と一般式 (III) で表されるアミン類とを、塩基又は酸触媒の存在下若しくは非存在下、不活性溶媒の存在下に反応させることにより、一般式 (V-1) で表されるフタルアミド酸類とし、該フタルアミド酸類 (V-1) を単離し又は単離せずして、 $R^4$ が水素原子を示すフタルアミド酸類 (V-1) の場合、塩基の存在下又は非存在下、縮合剤及び不活性溶媒の存在下に縮合反応を行い、一般式 (VI-1) で表  
 10

されるイソイミド誘導体とし、該イソイミド誘導体 (VI-1) を単離し又は単離せずして、塩基又は酸触媒の存在下若しくは非存在下、不活性溶媒の存在下に一般式 (IV) で表されるスルファモイルアミン類と反応させることにより、一般式 (I) で表されるスルホンアミド誘導体を製造することができ、 $R^4$ が水素原子  
5 以外の置換基を示すフタルアミド酸類 (V-1) の場合、一般式 (IV) で表されるスルファモイルアミン類とを塩基の存在下又は非存在下、縮合剤及び不活性溶媒の存在下に縮合させることにより、一般式 (I) で表されるスルホンアミド誘導体を製造することができる。

又、一般式 (II) で表されるフタル酸無水物類と一般式 (IV) で表されるス  
10 ルファモイルアミン類とを、塩基又は酸触媒の存在下若しくは非存在下、不活性溶媒の存在下に反応させることにより、一般式 (V-2) で表されるフタルアミド酸類とし、該フタルアミド酸類 (V-2) を単離し又は単離せずして、 $R^3$ が水素原子を示すフタルアミド酸類 (V-2) の場合、塩基の存在下又は非存在下、縮合剤及び不活性溶媒の存在下に縮合反応を行い、一般式 (VI-2) で表される  
15 イソイミド誘導体とし、該イソイミド誘導体 (VI-2) を単離し又は単離せずして、塩基又は酸触媒の存在下若しくは非存在下、不活性溶媒の存在下に一般式 (III) で表されるアミン類と反応させることにより、一般式 (I) で表されるスルホンアミド誘導体を製造することができ、 $R^3$ が水素原子以外の置換基を示すフタルアミド酸類 (V-2) の場合、一般式 (III) で表されるアミン類とを塩  
20 基の存在下又は非存在下、縮合剤及び不活性溶媒の存在下に縮合させることにより、一般式 (I) で表されるスルホンアミド誘導体を製造することができる。

1. 一般式 (II) → 一般式 (V-1) 又は一般式 (V-2)

本反応で利用できる酸としては、例えば酢酸、トリフルオロ酢酸等の有機酸類、塩酸、硫酸等の無機酸類を例示することができ、その使用量は、一般式 (II) で  
25 表されるフタル酸無水物類に対して触媒量乃至過剰モルの範囲から適宜選択して使用すれば良い。塩基としては、例えばトリエチルアミン、ピリジン等の有機塩基類、炭酸カリウム、炭酸水素ナトリウム、炭酸ナトリウム、水酸化ナトリウム等の無機塩基類を例示することができ、その使用量は、一般式 (II) で表されるフタル酸無水物類に対して触媒量乃至過剰モルの範囲から適宜選択して使用すれ

ば良い。

本反応で使用する不活性溶媒としては、本反応の進行を著しく阻害しないものであれば良く、例えばベンゼン、トルエン、キシレン等の芳香族炭化水素類、塩化メチレン、クロロホルム、四塩化炭素等のハロゲン化炭化水素類、クロロベンゼン、ジクロロベンゼン等のハロゲン化芳香族炭化水素類、ジエチルエーテル、ジオキサン、テトラヒドロフラン等の鎖状又は環状エーテル類、酢酸エチル等のエステル類、ジメチルホルムアミド、ジメチルアセトアミド等のアミド類、酢酸等の酸類、ジメチルスルホキシド、1, 3-ジメチル-2-イミダゾリジノン等の不活性溶媒を例示することができ、これらの不活性溶媒は単独で又は2種以上混合して使用することができる。

本反応は等モル反応であるので、各反応剤を等モル使用すれば良いが、いずれかを過剰に使用することもできる。

反応温度は室温乃至使用する不活性溶媒の沸点域で行うことができ、反応時間は反応規模、反応温度により一定しないが、数分乃至48時間の範囲で行えば良い。

反応終了後、目的物を含む反応系から常法により単離し又は単離せずして次の反応に使用することができる。

一般式 (II) で表されるフタル酸無水物類は J. Org. Chem., 52, 129 (1987)、J. Am. Chem. Soc., 51, 1865 (1929)、及び J. Am. Chem. Soc., 63, 1542 (1941) 等に記載の方法により製造することができる。

## 2. 一般式 (V-1) 又は一般式 (V-2) → 一般式 (I)

本反応で使用する不活性溶媒としては、本反応の進行を著しく阻害しないものであれば良く、例えば塩化メチレン、クロロホルム、四塩化炭素等のハロゲン化炭化水素類、ジエチルエーテル、ジオキサン、テトラヒドロフラン等の鎖状又は環状エーテル類、アセトニトリル等のニトリル類等の不活性溶媒を例示することができ、これらの不活性溶媒は単独で又は2種以上混合して使用することができる。

本反応で使用する縮合剤としては、通常のアミド製造に使用されるものであれ



ば良く、例えば無水トリフルオロ酢酸、クロロ炭酸エステル、向山試薬（2-クロロ-N-メチルピリジニウムヨード）、DCC（1, 3-ジシクロヘキシルカルボジイミド）、CDI（カルボニルジイミダゾール）、DEPC（シアノリン酸ジエチル）等を例示することができ、その使用量は一般式（V-1）又は（V-2）で表されるフタルアミド酸類に対して等モル乃至過剰モルの範囲から適宜選択して使用すれば良い。

本反応で利用できる塩基としては、例えばトリエチルアミン、ピリジン等の有機塩基類、炭酸カリウム等の無機塩基類を例示することができ、その使用量は一般式（V-1）又は一般式（V-2）で表されるフタルアミド酸類に対して等モル乃至過剰モルの範囲から適宜選択して使用すれば良い。

反応温度は0℃乃至使用する不活性溶媒の沸点域で行うことができ、反応時間は反応規模、反応温度により一定しないが、数分乃至48時間の範囲で行えば良い。

反応終了後、目的物を含む反応系から常法により単離すれば良く、必要に応じて再結晶、カラムクロマトグラフィー等で精製することにより目的物を製造することができる。

3. 一般式（V-1）→ 一般式（VI-1）又は  
一般式（V-2）→ 一般式（VI-2）

本反応は、例えばJ. Med. Chem., 10, 982 (1967)に記載の方法に従って目的物を製造することができる。

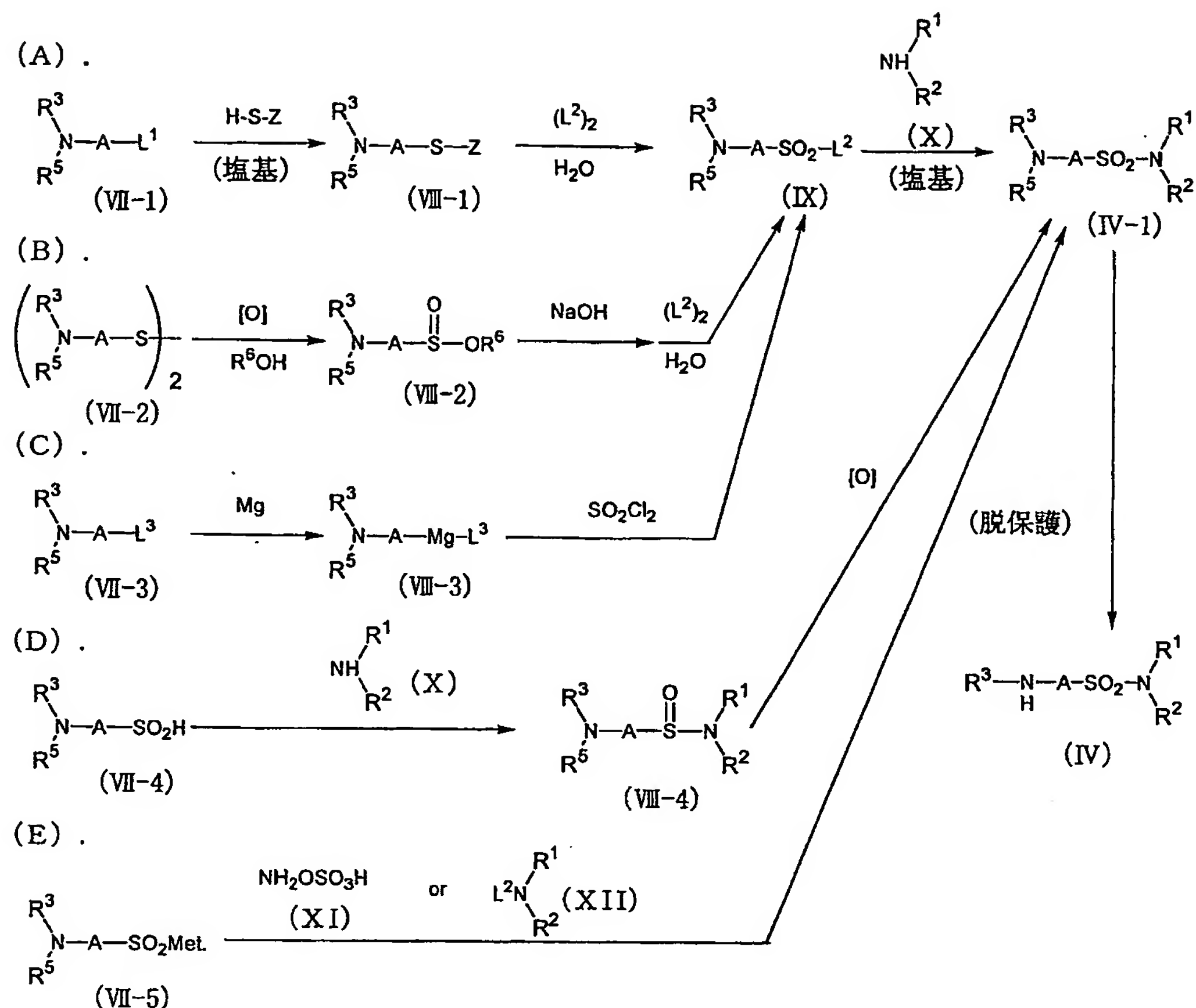
反応終了後、目的物を含む反応系から常法により単離し又は単離せずして次の反応に使用することができる。

4. 一般式（VI-1）又は一般式（VI-2）→ 一般式（I）

本反応は1.と同様にすることにより、目的物を製造することができる。

反応終了後、目的物を含む反応系から常法により単離すれば良く、必要に応じて再結晶、カラムクロマトグラフィー等で精製することにより目的物を製造することができる。

原料であるスルファモイルアミン類（IV）は例えば以下に図示する文献記載の方法に準じて製造することができる。



(式中、 $\text{R}^1$ 、 $\text{R}^2$ 、 $\text{R}^3$ 及び $\text{A}$ は前記に同じくし、 $\text{R}^5$ はベンジルオキシカルボニル基、ターシャリーブトキシカルボニル基、アルキルシリル基等の保護基を示し、 $\text{R}^6$ は $\text{C}_1$ - $\text{C}_6$ アルキル基を示し、 $\text{L}^1$ 、 $\text{L}^2$ 及び $\text{L}^3$ はハロゲン原子等の脱離基を示し、 $\text{Met}$ はナトリウム、カリウム等の金属原子を示し、 $\text{Z}$ は水素原子、 $\text{C}_1$ - $\text{C}_6$ アルキル基又はベンジル基を示す。)

(A) . 一般式 (VII-1)  $\rightarrow$  一般式 (IV)

一般式 (VII-1) で表されるアミン誘導体を J. Am. Chem. Soc. , 58, 1348 (1936) 、 J. Am. Chem. Soc. , 60, 1486 (1938) 等に記載の方法に従い、チオール類と反応させることによりチオアルキルアミン誘導体 (VIII-1) とし、該チオアルキルアミン誘導体を単離し又は単離せずして、ハロゲン類と反応させることにより、一般式 (IX) で表されるスルホニルハライド誘導体とし、該スルホニルハライド誘導体を

Synthesis, 1970, 545、J. Org. Chem. , 21, 66

7 (1956) 等に記載の方法に従い、一般式 (X) で表されるアミン類と反応させることにより一般式 (IV-1) で表されるスルホンアミド誘導体とし、該スルホンアミド誘導体を常法に従い脱保護反応を行うことにより、一般式 (IV) で表されるスルファモイルアミン類を製造することができる。

5 (B) . 一般式 (VII-2) → 一般式 (IV)

一般式 (VII-2) で表されるジスルフィド誘導体を Synth.

Commun. , 27, 1321 (1997) 、 Synthesis, 1988, 252 等に記載の方法に従い、スルフェン酸エステル誘導体 (VIII-2) とし、該スルフェン酸エステル誘導体を単離し又は単離せずして、加水分解反応を行い、

10 J. Am. Chem. Soc. , 45, 1068 (1923) 等に記載の方法に従い、ハロゲン類と反応させることにより、一般式 (IX) で表されるスルホニルハライド誘導体とし、以下 (A) と同様にして一般式 (IV) で表されるスルファモイルアミン類を製造することができる。

(C) . 一般式 (VII-3) → 一般式 (IV)

15 一般式 (VII-3) で表されるアミン誘導体を J. Org. Chem. , 20, 1159 (1955) 等に記載の方法に従い、グリニャール試薬 (VIII-3) とし、スルフリルクロライドと反応させることにより、一般式 (IX) で表されるスルホニルハライド誘導体とし、以下 (A) と同様にして一般式 (IV) で表されるスルファモイルアミン類を製造することができる。

20 (D) . 一般式 (VII-4) → 一般式 (IV)

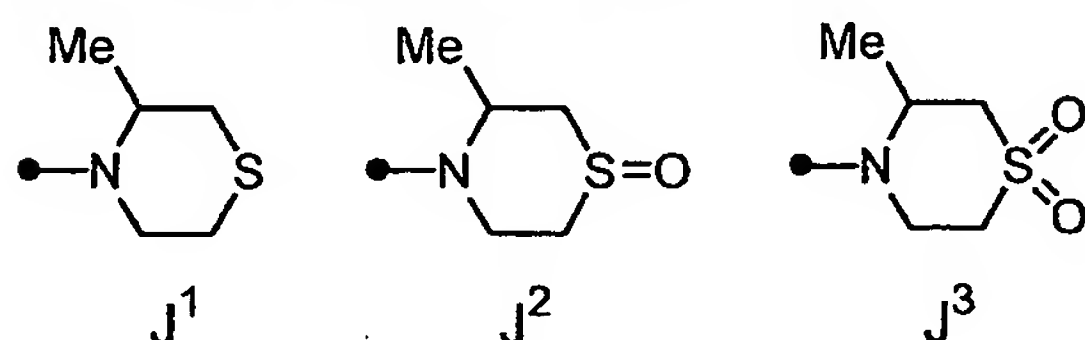
一般式 (VII-4) で表されるスルフェン酸誘導体と一般式 (X) で表されるアミン誘導体から J. Am. Chem. Soc. , 57, 2172 (1935) 、 Chem. Lett, 1976, 149 等に記載の方法に従い、一般式 (VIII-4) で表されるスルフェンアミド誘導体とし、該スルフェンアミド誘導体を、

25 J. Org. Chem. , 31, 2357 (1966) 等に記載の方法に従い、一般式 (IV-1) で表されるスルホンアミド誘導体とし、以下 (A) と同様に脱保護することにより、一般式 (IV) で表されるスルファモイルアミン類を製造することができる。

(E) . 一般式 (VII-5) → 一般式 (IV)

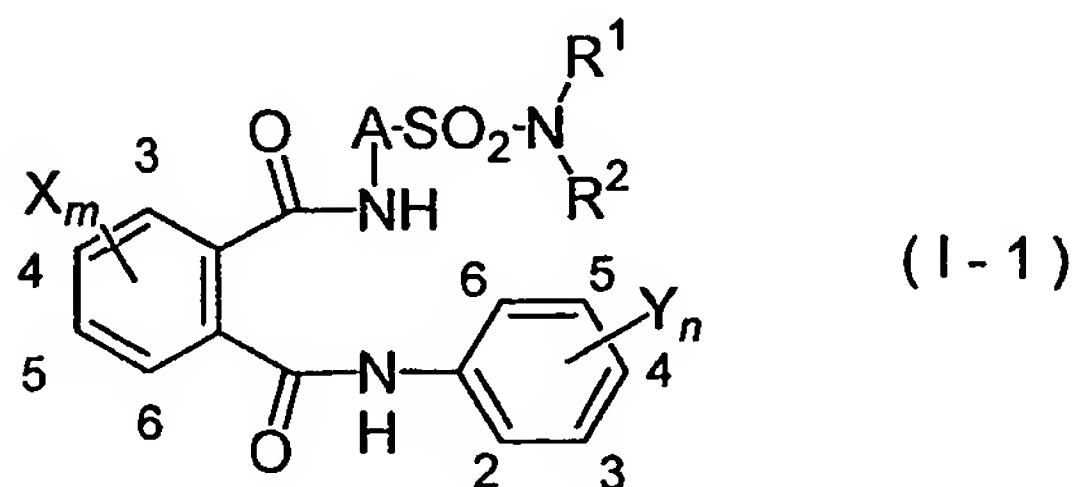
一般式 (IV) で表されるスルファモイルアミンのうち、 $R^1$ 及び $R^2$ が水素原子であるスルファモイルアミンは一般式 (VII-5) で表されるスルフェン酸塩誘導体とヒドロキシルアミン- $\alpha$ -スルホン酸 (XI) から *Synthesis*, 1985, 1032 に記載の方法に従い、一般式 (IV-1) で表されるスルホンアミド誘導体とし、以下 (A) と同様に脱保護することにより、製造することができる。また、一般式 (VII-5) で表されるスルフェン酸塩誘導体と一般式 (XII) で表されるN-ハロ置換アミン類から、*J. Org. Chem.*, 46, 5077 (1981) に記載の方法に従い、一般式 (IV-1) で表されるスルホンアミド誘導体とし、以下 (A) と同様に脱保護することにより、一般式 (IV) で表されるスルファモイルアミン類を製造することもできる。

以下に一般式 (I) で表されるスルホンアミド誘導体の代表的な化合物を第1表及び第2表に例示するが、本発明はこれらに限定されるものではない。以下の表において、「n」はノルマルを、「s」はセカンダリーを、「t」はターシャリーを、「i」はイソを、「c」はシクロを、「Me」はメチル基を、「Et」はエチル基を、「Pr」はプロピル基を、「Bu」はブチル基を、「Pen」はペンチル基を、「Hex」はヘキシル基を、「Ph」はフェニル基を、「Py」はピリジル基を、「C<sup>\*</sup>」は不斉炭素を示す。又、「J<sup>1</sup>」、「J<sup>2</sup>」、「J<sup>3</sup>」は以下に表わされる置換基を示す。



20

一般式 (I-1)





第 1 表

N o	-A-SO <sub>2</sub> NR <sup>1</sup> R <sup>2</sup>	X <sub>m</sub>	Y <sub>n</sub>	物性 融点℃
1-1	CHMeCH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>	3-I	2-Me-4-CF(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	217-219
1-2	CHMeCH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> NHMe	3-I	2-Me-4-CF(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	186-188
1-3	CHMeCH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> NMe <sub>2</sub>	3-I	2-Me-4-CF(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	122-125
1-4	CHMeCH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> NHEt	3-I	2-Me-4-CF(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	170-172
1-5	CHMeCH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> N(Me)Et	3-I	2-Me-4-CF(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	
1-6	CHMeCH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> NEt <sub>2</sub>	3-I	2-Me-4-CF(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	116
1-7	CHMeCH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> NH-n-Pr	3-I	2-Me-4-CF(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	147-150
1-8	CHMeCH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> NH-i-Pr	3-I	2-Me-4-CF(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	204-206
1-9	CHMeCH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> NH-c-Pr	3-I	2-Me-4-CF(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	
1-10	CHMeCH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> N(n-Pr) <sub>2</sub>	3-I	2-Me-4-CF(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	
1-11	CHMeCH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> N(i-Pr) <sub>2</sub>	3-I	2-Me-4-CF(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	
1-12	CHMeCH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> NH-n-Bu	3-I	2-Me-4-CF(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	178-181
1-13	CHMeCH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> NH-s-Bu	3-I	2-Me-4-CF(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	
1-14	CHMeCH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> NH-t-Bu	3-I	2-Me-4-CF(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	195-197
1-15	CHMeCH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> NH-i-Bu	3-I	2-Me-4-CF(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	
1-16	CHMeCH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> NH-c-Bu	3-I	2-Me-4-CF(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	
1-17	CHMeCH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> NH-c-Pen	3-I	2-Me-4-CF(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	
1-18	CHMeCH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> NH-c-Hex	3-I	2-Me-4-CF(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	
1-19	CHMeCH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> NHCH <sub>2</sub> -c-Pr	3-I	2-Me-4-CF(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	
1-20	CHMeCH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> NHCH <sub>2</sub> CH=CH <sub>2</sub>	3-I	2-Me-4-CF(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	109-113
1-21	CHMeCH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> NHCH <sub>2</sub> C≡CH	3-I	2-Me-4-CF(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	111-113
1-22	CHMeCH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> NHCH <sub>2</sub> Ph	3-I	2-Me-4-CF(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	200-202
1-23	CHMeCH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> NHCH <sub>2</sub> -(2-F-Ph)	3-I	2-Me-4-CF(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	195-198
1-24	CHMeCH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> NHCH <sub>2</sub> -(2-Cl-Ph)	3-I	2-Me-4-CF(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	193-196
1-25	CHMeCH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> NHCH <sub>2</sub> -(2-Br-Ph)	3-I	2-Me-4-CF(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	189-192
1-26	CHMeCH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> NHCH <sub>2</sub> -(2-Me-Ph)	3-I	2-Me-4-CF(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	
1-27	CHMeCH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> NHCH <sub>2</sub> -(2-OMe-Ph)	3-I	2-Me-4-CF(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	180-183
1-28	CHMeCH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> NHCH <sub>2</sub> -(2-NO <sub>2</sub> -Ph)	3-I	2-Me-4-CF(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	173-177

N o	-A-S O <sub>2</sub> N R <sup>1</sup> R <sup>2</sup>	X <sub>m</sub>	Y <sub>n</sub>	物性 融点℃
1-29	CHMeCH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> NHCH <sub>2</sub> -(3-OMe-Ph)	3-I	2-Me-4-CF(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	196-198
1-30	CHMeCH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> NHCH <sub>2</sub> -(3-NO <sub>2</sub> -Ph)	3-I	2-Me-4-CF(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	155-160
1-31	CHMeCH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> NHCH <sub>2</sub> -(3-CN-Ph)	3-I	2-Me-4-CF(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	147-150
1-32	CHMeCH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> NHCH <sub>2</sub> -(2,6-(OMe) <sub>2</sub> -Ph)	3-I	2-Me-4-CF(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	210-213
1-33	CHMeCH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> NHCH <sub>2</sub> -(4-Cl-Ph)	3-I	2-Me-4-CF(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	
1-34	CHMeCH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> NHCH <sub>2</sub> -(4-Me-Ph)	3-I	2-Me-4-CF(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	
1-35	CHMeCH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> NHCH <sub>2</sub> -(4-MeO-Ph)	3-I	2-Me-4-CF(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	176-179
1-36	CHMeCH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> NHCH <sub>2</sub> -(4-NO <sub>2</sub> -Ph)	3-I	2-Me-4-CF(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	185-187
1-37	CHMeCH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> NHCH <sub>2</sub> -(4-CN-Ph)	3-I	2-Me-4-CF(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	169-171
1-38	CHMeCH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> NHCH <sub>2</sub> -(4-SCF <sub>3</sub> -Ph)	3-I	2-Me-4-CF(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	201-204
1-39	CHMeCH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> NHCH <sub>2</sub> -2-Py	3-I	2-Me-4-CF(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	228-231
1-40	CHMeCH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> NHCH <sub>2</sub> -3-Py	3-I	2-Me-4-CF(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	144-147
1-41	CHMeCH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> NHCH <sub>2</sub> -4-Py	3-I	2-Me-4-CF(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	166-168
1-42	CHMeCH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> N(Me)CH <sub>2</sub> Ph	3-I	2-Me-4-CF(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	186-189
1-43	CHMeCH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> N(Et)CH <sub>2</sub> Ph	3-I	2-Me-4-CF(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	184-186
1-44	CHMeCH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> NHCH(Me)Ph	3-I	2-Me-4-CF(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	173-175
1-45	CHMeCH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> NHC <sup>*</sup> H(Me)Ph R-enantiomer	3-I	2-Me-4-CF(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	168-170
1-46	CHMeCH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> NHC <sup>*</sup> H(Me)Ph S-enantiomer	3-I	2-Me-4-CF(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	159-161
1-47	CHMeCH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> NHCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> Ph	3-I	2-Me-4-CF(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	203-206
1-48	CHMeCH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> NHC(Me) <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> Ph	3-I	2-Me-4-CF(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	197-198
1-49	CHMeCH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> N(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub>	3-I	2-Me-4-CF(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	
1-50	CHMeCH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> N(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub>	3-I	2-Me-4-CF(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	
1-51	CHMeCH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> N(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub>	3-I	2-Me-4-CF(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	
1-52	CHMeCH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> N(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub>	3-I	2-Me-4-CF(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	
1-53	CHMeCH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> N(CH <sub>2</sub> ) <sub>6</sub>	3-I	2-Me-4-CF(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	
1-54	CHMeCH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> N(CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> O	3-I	2-Me-4-CF(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	204-207
1-55	CHMeCH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> N(CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> S	3-I	2-Me-4-CF(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	191-194
1-56	CHMeCH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> N(CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> SO	3-I	2-Me-4-CF(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	195-198

N o	-A-SO <sub>2</sub> NR <sup>1</sup> R <sup>2</sup>	X <sub>m</sub>	Y <sub>n</sub>	物性 融点℃
1-57	CHMeCH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> N(CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> SO <sub>2</sub>	3-I	2-Me-4-CF(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	237-240
1-58	CMe <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> N(CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> S	3-I	2-Me-4-CF(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	164-165
1-59	CMe <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> N(CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> SO	3-I	2-Me-4-CF(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	167-168
1-60	CMe <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> N(CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> SO <sub>2</sub>	3-I	2-Me-4-CF(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	166-167
1-61	CMe <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> J <sup>1</sup>	3-I	2-Me-4-CF(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	207-208
1-62	CMe <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> J <sup>2</sup>	3-I	2-Me-4-CF(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	アモルファス
1-63	CMe <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> J <sup>3</sup>	3-I	2-Me-4-CF(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	157-159
1-64	CHMeCH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> N(CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> NH	3-I	2-Me-4-CF(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	
1-65	CHMeCH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> N(CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> NMe	3-I	2-Me-4-CF(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	
1-66	CHMeCH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> N(CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> NCOMe	3-I	2-Me-4-CF(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	196-198
1-67	CHMeCH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> N(CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> C=O	3-I	2-Me-4-CF(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	209-211
1-68	CHMeCH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> NHCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	3-I	2-Me-4-CF(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	
1-69	CHMeCH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> NHCH(Me)CF <sub>3</sub>	3-I	2-Me-4-CF(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	
1-70	CHMeCH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> NHCH <sub>2</sub> CH=CCl <sub>2</sub>	3-I	2-Me-4-CF(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	
1-71	CHMeCH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> NH(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> Cl	3-I	2-Me-4-CF(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	90-95
1-72	CHMeCH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> NH(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> OH	3-I	2-Me-4-CF(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	171-174
1-73	CHMeCH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> NH(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> OMe	3-I	2-Me-4-CF(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	142-144
1-74	CHMeCH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> NHCHMeCH <sub>2</sub> OMe	3-I	2-Me-4-CF(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	
1-75	CHMeCH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> NH(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> SMe	3-I	2-Me-4-CF(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	156-158
1-76	CHMeCH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> NH(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> SOMe	3-I	2-Me-4-CF(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	132-134
1-77	CHMeCH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> NH(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> Me	3-I	2-Me-4-CF(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	186-189
1-78	CMe <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> NH(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> OH	3-I	2-Me-4-CF(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	150-151
1-79	CMe <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> NH(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> OMe	3-I	2-Me-4-CF(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	167-168
1-80	CMe <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> NH(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> OCOMe	3-I	2-Me-4-CF(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	181-182
1-81	CMe <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> NH(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> SMe	3-I	2-Me-4-CF(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	161-162
1-82	CMe <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> NH(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> SOMe	3-I	2-Me-4-CF(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	154-155
1-83	CMe <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> NH(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> Me	3-I	2-Me-4-CF(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	151-152
1-84	CMe <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> NH(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> SEt	3-I	2-Me-4-CF(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	166-167
1-85	CMe <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> NH(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> SOEt	3-I	2-Me-4-CF(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	144-145

N o	-A-SO <sub>2</sub> NR <sup>1</sup> R <sup>2</sup>	X <sub>m</sub>	Y <sub>n</sub>	物性 融点℃
1-86	CMe <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> NH(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> Et	3-I	2-Me-4-CF(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	168-169
1-87	CMe <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> NH(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> SPh	3-I	2-Me-4-CF(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	155-156
1-88	CMe <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> NH(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> SOPh	3-I	2-Me-4-CF(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	151-153
1-89	CMe <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> NH(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> Ph	3-I	2-Me-4-CF(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	170-172
1-90	CMe <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> NH(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> NMe <sub>2</sub>	3-I	2-Me-4-CF(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	
1-91	CHMeCH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> NHCHMeCH <sub>2</sub> SMe	3-I	2-Me-4-CF(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	190-193
1-92	CHMeCH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> NHCHMeCH <sub>2</sub> SOMe	3-I	2-Me-4-CF(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	130-133
1-93	CHMeCH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> NHCHMeCH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> Me	3-I	2-Me-4-CF(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	150-154
1-94	CHMeCH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> NCMe <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SMe	3-I	2-Me-4-CF(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	157-160
1-95	CHMeCH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> NH(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> OMe	3-I	2-Me-4-CF(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	
1-96	CMe <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> NH(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> SMe	3-I	2-Me-4-CF(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	
1-97	CMe <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> NH(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> SOMe	3-I	2-Me-4-CF(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	
1-98	CMe <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> NH(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> SO <sub>2</sub> Me	3-I	2-Me-4-CF(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	
1-99	CHMeCH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> NHCH <sub>2</sub> CN	3-I	2-Me-4-CF(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	
1-100	CHMeCH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> NHCH <sub>2</sub> CO <sub>2</sub> Me	3-I	2-Me-4-CF(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	
1-101	CHMeCH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> NHCH <sub>2</sub> CO <sub>2</sub> Et	3-I	2-Me-4-CF(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	
1-102	CHMeCH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> NHCHMeCO <sub>2</sub> Me	3-I	2-Me-4-CF(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	
1-103	CHMeCH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> NHCHMeCONH <sub>2</sub>	3-I	2-Me-4-CF(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	228-230
1-104	CHMeCH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> NHCHMeCONHEt	3-I	2-Me-4-CF(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	176-177
1-105	CHMeCH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> NHCH <sub>2</sub> CONEt <sub>2</sub>	3-I	2-Me-4-CF(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	172-174
1-106	CHMeCH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> NHPh	3-I	2-Me-4-CF(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	232-234
1-107	CHMeCH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> NH(2-F-Ph)	3-I	2-Me-4-CF(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	211-212
1-108	CHMeCH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> NH(2-MeO-Ph)	3-I	2-Me-4-CF(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	101-106
1-109	CHMeCH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> NH(3-F-Ph)	3-I	2-Me-4-CF(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	235-236
1-110	CHMeCH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> NH(4-F-Ph)	3-I	2-Me-4-CF(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	228-233
1-111	CHMeCH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> NH(4-MeO-Ph)	3-I	2-Me-4-CF(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	143-147
1-112	CHMeCH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> NH(4-MeS-Ph)	3-I	2-Me-4-CF(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	165-170
1-113	CHMeCH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> NH-2-Py	3-I	2-Me-4-CF(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	
1-114	CHMeCH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> NH-3-Py	3-I	2-Me-4-CF(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	



No	-A-SO <sub>2</sub> NR <sup>1</sup> R <sup>2</sup>	X <sub>m</sub>	Y <sub>n</sub>	物性 融点℃
1-115	CHMeCH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> NHOH	3-I	2-Me-4-CF(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	200-205
1-116	CHMeCH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> NHOMe	3-I	2-Me-4-CF(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	
1-117	CHMeCH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> NMeOMe	3-I	2-Me-4-CF(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	
1-118	CHMeCH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> NHNH <sub>2</sub>	3-I	2-Me-4-CF(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	
1-119	CHMeCH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> NMeNH <sub>2</sub>	3-I	2-Me-4-CF(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	
1-120	CHMeCH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> NMeNHMe	3-I	2-Me-4-CF(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	161-166
1-121	CHMeCH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> NHNMe <sub>2</sub>	3-I	2-Me-4-CF(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	
1-122	CHMeCH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> NHNHPh	3-I	2-Me-4-CF(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	
1-123	CHMeCH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> NHNHCOMe	3-I	2-Me-4-CF(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	
1-124	CHMeCH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> NHNHCOPh	3-I	2-Me-4-CF(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	
1-125	CHMeCH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> NHN=CMe <sub>2</sub>	3-I	2-Me-4-CF(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	
1-126	CHMeCH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> NHN=CHPh	3-I	2-Me-4-CF(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	
1-127	CHMeCH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> NHN=C(Me)Ph	3-I	2-Me-4-CF(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	
1-128	CHMeCH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> N=CHMe	3-I	2-Me-4-CF(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	
1-129	CHMeCH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> N=CHEt	3-I	2-Me-4-CF(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	
1-130	CHMeCH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> N=CH-i-Pr	3-I	2-Me-4-CF(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	
1-131	CHMeCH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> N=CHPh	3-I	2-Me-4-CF(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	
1-132	CHMeCH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> N=CHNHMe	3-I	2-Me-4-CF(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	
1-133	CHMeCH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> N=CHNMe <sub>2</sub>	3-I	2-Me-4-CF(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	
1-134	CHMeCH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> N=CHNEt <sub>2</sub>	3-I	2-Me-4-CF(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	
1-135	C <sup>*</sup> HMeCH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> NH <sub>2</sub> R-enantiomer	3-I	2-Me-4-CF(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	
1-136	C <sup>*</sup> HMeCH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> NH <sub>2</sub> S-enantiomer	3-I	2-Me-4-CF(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	
1-137	C <sup>*</sup> HMeCH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> NHMe R-enantiomer	3-I	2-Me-4-CF(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	
1-138	C <sup>*</sup> HMeCH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> NHMe S-enantiomer	3-I	2-Me-4-CF(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	
1-139	C <sup>*</sup> HMeCH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> NMe <sub>2</sub> R-enantiomer	3-I	2-Me-4-CF(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	

No	-A-SO <sub>2</sub> NR <sup>1</sup> R <sup>2</sup>	X <sub>m</sub>	Y <sub>n</sub>	物性 融点°C
1-140	C <sup>*</sup> HMeCH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> NMe <sub>2</sub> S-enantiomer	3-I	2-Me-4-CF(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	
1-141	C <sup>*</sup> HMeCH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> NHEt R-enantiomer	3-I	2-Me-4-CF(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	
1-142	C <sup>*</sup> HMeCH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> NHEt S-enantiomer	3-I	2-Me-4-CF(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	105-107
1-143	C <sup>*</sup> HMeCH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> NEt <sub>2</sub> R-enantiomer	3-I	2-Me-4-CF(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	
1-144	C <sup>*</sup> HMeCH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> NEt <sub>2</sub> S-enantiomer	3-I	2-Me-4-CF(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	159-163
1-145	C <sup>*</sup> HMeCH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> NHCH <sub>2</sub> Ph R-enantiomer	3-I	2-Me-4-CF(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	
1-146	C <sup>*</sup> HMeCH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> NHCH <sub>2</sub> Ph S-enantiomer	3-I	2-Me-4-CF(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	158-159
1-147	C <sup>*</sup> HMeCH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> NHC <sup>*</sup> HMeCH <sub>2</sub> SMe S, S-enantiomer	3-I	2-Me-4-CF(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	アモルファス
1-148	C <sup>*</sup> HMeCH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> NHC <sup>*</sup> HMeCH <sub>2</sub> SOMe S, S-enantiomer	3-I	2-Me-4-CF(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	115-120
1-149	C <sup>*</sup> HMeCH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> NHC <sup>*</sup> HMeCH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> Me S, S-enantiomer	3-I	2-Me-4-CF(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	アモルファス
1-150	CHMeSO <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>	3-I	2-Me-4-CF(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	
1-151	CHMeSO <sub>2</sub> NHMe	3-I	2-Me-4-CF(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	
1-152	CHMeSO <sub>2</sub> NMe <sub>2</sub>	3-I	2-Me-4-CF(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	
1-153	CHMeSO <sub>2</sub> NHEt	3-I	2-Me-4-CF(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	
1-154	CHMeSO <sub>2</sub> NEt <sub>2</sub>	3-I	2-Me-4-CF(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	
1-155	CHMe(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>	3-I	2-Me-4-CF(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	
1-156	CHMe(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> NHMe	3-I	2-Me-4-CF(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	
1-157	CHMe(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> NMe <sub>2</sub>	3-I	2-Me-4-CF(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	
1-158	CHMe(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> NHEt	3-I	2-Me-4-CF(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	
1-159	CHMe(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> NEt <sub>2</sub>	3-I	2-Me-4-CF(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	
1-160	C <sup>*</sup> HMe(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> NH <sub>2</sub> S-enantiomer	3-I	2-Me-4-CF(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	

N o	-A-SO <sub>2</sub> NR <sup>1</sup> R <sup>2</sup>	X <sub>m</sub>	Y <sub>n</sub>	物性 融点℃
1-161	C <sup>*</sup> HMe(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> NHMe S-enantiomer	3-I	2-Me-4-CF(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	
1-162	C <sup>*</sup> HMe(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> NMe <sub>2</sub> S-enantiomer	3-I	2-Me-4-CF(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	
1-163	C <sup>*</sup> HMe(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> NHEt S-enantiomer	3-I	2-Me-4-CF(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	
1-164	C <sup>*</sup> HMe(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> NEt <sub>2</sub> S-enantiomer	3-I	2-Me-4-CF(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	
1-165	CHMe(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> SO <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>	3-I	2-Me-4-CF(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	
1-166	CHMe(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> SO <sub>2</sub> NHMe	3-I	2-Me-4-CF(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	
1-167	CHMe(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> SO <sub>2</sub> NMe <sub>2</sub>	3-I	2-Me-4-CF(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	
1-168	CHMe(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> SO <sub>2</sub> NHEt	3-I	2-Me-4-CF(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	
1-169	CHMe(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> SO <sub>2</sub> NEt <sub>2</sub>	3-I	2-Me-4-CF(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	
1-170	CHMe(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> SO <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>	3-I	2-Me-4-CF(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	
1-171	CHMe(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> SO <sub>2</sub> NHMe	3-I	2-Me-4-CF(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	
1-172	CHMe(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> SO <sub>2</sub> NMe <sub>2</sub>	3-I	2-Me-4-CF(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	
1-173	CHMe(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> SO <sub>2</sub> NHEt	3-I	2-Me-4-CF(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	
1-174	CHMe(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> SO <sub>2</sub> NEt <sub>2</sub>	3-I	2-Me-4-CF(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	
1-175	CMe <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>	3-I	2-Me-4-CF(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	アモルファス
1-176	CMe <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> NHMe	3-I	2-Me-4-CF(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	アモルファス
1-177	CMe <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> NMe <sub>2</sub>	3-I	2-Me-4-CF(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	151-152
1-178	CMe <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> NHEt	3-I	2-Me-4-CF(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	アモルファス
1-179	CMe <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> NEt <sub>2</sub>	3-I	2-Me-4-CF(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	アモルファス
1-180	CMe <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> NH-n-Bu	3-I	2-Me-4-CF(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	185-186
1-181	CMe <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> N(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub>	3-I	2-Me-4-CF(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	129-130
1-182	CMe <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> NHCH <sub>2</sub> CH=CH <sub>2</sub>	3-I	2-Me-4-CF(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	
1-183	CMe <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> NHCH <sub>2</sub> C≡CH	3-I	2-Me-4-CF(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	
1-184	CMe <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> NHCH <sub>2</sub> Ph	3-I	2-Me-4-CF(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	152-153
1-185	CMe <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> NHPh	3-I	2-Me-4-CF(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	
1-186	CMe <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> NH-2-Py	3-I	2-Me-4-CF(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	

N o	-A-SO <sub>2</sub> NR <sup>1</sup> R <sup>2</sup>	X <sub>m</sub>	Y <sub>n</sub>	物性 融点℃
1-187	CMe <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>	3-I	2-Me-4-CF(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	
1-188	CMe <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> NHMe	3-I	2-Me-4-CF(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	
1-189	CMe <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> NMe <sub>2</sub>	3-I	2-Me-4-CF(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	
1-190	CMe <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> NHEt	3-I	2-Me-4-CF(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	
1-191	CMe <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> NEt <sub>2</sub>	3-I	2-Me-4-CF(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	
1-192	CMe <sub>2</sub> (CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>	3-I	2-Me-4-CF(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	
1-193	CMe <sub>2</sub> (CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> NHMe	3-I	2-Me-4-CF(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	
1-194	CMe <sub>2</sub> (CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> NMe <sub>2</sub>	3-I	2-Me-4-CF(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	
1-195	CMe <sub>2</sub> (CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> NHEt	3-I	2-Me-4-CF(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	
1-196	CMe <sub>2</sub> (CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> NEt <sub>2</sub>	3-I	2-Me-4-CF(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	
1-197	CMe <sub>2</sub> (CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> SO <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>	3-I	2-Me-4-CF(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	
1-198	CMe <sub>2</sub> (CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> SO <sub>2</sub> NHMe	3-I	2-Me-4-CF(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	
1-199	CMe <sub>2</sub> (CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> SO <sub>2</sub> NMe <sub>2</sub>	3-I	2-Me-4-CF(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	
1-200	CMe <sub>2</sub> (CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> SO <sub>2</sub> NHEt	3-I	2-Me-4-CF(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	185-186
1-201	CMe <sub>2</sub> (CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> SO <sub>2</sub> NEt <sub>2</sub>	3-I	2-Me-4-CF(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	142-145
1-202	CMe <sub>2</sub> (CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> SO <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>	3-I	2-Me-4-CF(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	
1-203	CMe <sub>2</sub> (CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> SO <sub>2</sub> NHMe	3-I	2-Me-4-CF(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	
1-204	CMe <sub>2</sub> (CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> SO <sub>2</sub> NMe <sub>2</sub>	3-I	2-Me-4-CF(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	
1-205	CMe <sub>2</sub> (CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> SO <sub>2</sub> NHEt	3-I	2-Me-4-CF(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	
1-206	CMe <sub>2</sub> (CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> SO <sub>2</sub> NEt <sub>2</sub>	3-I	2-Me-4-CF(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	
1-207	CHMeCH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> NHEt	H	2-Me-4-CF(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	120-121
1-208	CMe <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> NEt <sub>2</sub>	H	2-Me-4-CF(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	93-94
1-209	CHMeCH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> NHEt	3-F	2-Me-4-CF(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	
1-210	CHMeCH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> NHEt	3-Cl	2-Me-4-CF(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	
1-211	CHMeCH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> NEt <sub>2</sub>	3-Cl	2-Me-4-CF(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	103-108
1-212	CHMeCH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> NHEt	3-Br	2-Me-4-CF(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	136-138
1-213	CHMeCH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> NMe <sub>2</sub>	3-Br	2-Me-4-CF(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	107-110
1-214	CHMeCH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> NEt <sub>2</sub>	3-Br	2-Me-4-CF(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	112-115
1-215	CHMeCH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> NH-n-Pr	3-Br	2-Me-4-CF(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	159-161



N o	-A-S O <sub>2</sub> N R <sup>1</sup> R <sup>2</sup>	X <sub>m</sub>	Y <sub>n</sub>	物性 融点℃
1-216	CHMeCH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> NH-i-Pr	3-Br	2-Me-4-CF(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	185-187
1-217	CHMeCH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> NH-n-Bu	3-Br	2-Me-4-CF(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	179-181
1-218	CHMeCH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> NHCH <sub>2</sub> Ph	3-Br	2-Me-4-CF(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	139-141
1-219	CMe <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> NEt <sub>2</sub>	3-Br	2-Me-4-CF(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	169-170
1-220	CHMeCH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> NHEt	3, 4-Cl <sub>2</sub>	2-Me-4-CF(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	
1-221	CHMeCH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> NHEt	3, 4-Br <sub>2</sub>	2-Me-4-CF(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	
1-222	CHMeCH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> NHEt	4-Cl	2-Me-4-CF(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	
1-223	CHMeCH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> NHEt	4-Br	2-Me-4-CF(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	
1-224	CHMeCH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> NHEt	4-I	2-Me-4-CF(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	
1-225	CHMeCH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> NHEt	3-NO <sub>2</sub>	2-Me-4-CF(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	
1-226	CHMeCH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> NHEt	3-NH <sub>2</sub>	2-Me-4-CF(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	
1-227	CHMeCH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> NHEt	3-N(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	2-Me-4-CF(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	
1-228	CHMeCH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> NHEt	3-NHCOCH <sub>3</sub>	2-Me-4-CF(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	
1-229	CHMeCH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> NHEt	3-NHCOCF <sub>3</sub>	2-Me-4-CF(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	
1-230	CHMeCH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> NHEt	3-NHSO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	2-Me-4-CF(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	
1-231	CHMeCH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> NHEt	3-NHSO <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	2-Me-4-CF(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	
1-232	CHMeCH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> NHEt	3-CH <sub>3</sub>	2-Me-4-CF(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	
1-233	CHMeCH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> NHEt	3-CF <sub>3</sub>	2-Me-4-CF(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	
1-234	CHMeCH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> NHEt	3-OCH <sub>3</sub>	2-Me-4-CF(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	
1-235	CHMeCH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> NHEt	3-OCF <sub>3</sub>	2-Me-4-CF(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	
1-236	CHMeCH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> NHEt	3-OCOCH <sub>3</sub>	2-Me-4-CF(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	
1-237	CHMeCH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> NHEt	3-OCOCF <sub>3</sub>	2-Me-4-CF(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	
1-238	CHMeCH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> NHEt	3-SCH <sub>3</sub>	2-Me-4-CF(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	
1-239	CHMeCH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> NHEt	3-SOCH <sub>3</sub>	2-Me-4-CF(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	
1-240	CHMeCH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> NHEt	3-SO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	2-Me-4-CF(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	
1-241	CHMeCH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> NHEt	3-SCF <sub>3</sub>	2-Me-4-CF(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	
1-242	CHMeCH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> NHEt	3-SOCF <sub>3</sub>	2-Me-4-CF(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	
1-243	CHMeCH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> NHEt	3-SO <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	2-Me-4-CF(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	
1-244	CHMeCH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> NHEt	3-OSO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	2-Me-4-CF(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	

N o	-A-SO <sub>2</sub> NR <sup>1</sup> R <sup>2</sup>	X <sub>m</sub>	Y <sub>n</sub>	物性 融点℃
1-245	CHMeCH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> NHEt	3-OSO <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	2-Me-4-CF(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	
1-246	CHMeCH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> NHEt	3-C≡CH	2-Me-4-CF(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	
1-247	CHMeCH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> NHEt	3-C≡CCF <sub>3</sub>	2-Me-4-CF(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	
1-248	CHMeCH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> NHEt	3-CN	2-Me-4-CF(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	
1-249	CHMeCH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> NHEt	3- CHCHCHCH-4	2-Me-4-CF(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	
1-250	CHMeCH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> NHEt	3-OCF <sub>2</sub> O-4	2-Me-4-CF(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	
1-251	CHMeCH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> NHEt	3- OCF <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> O-4	2-Me-4-CF(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	
1-252	CHMeCH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> NHEt	3-I	2-Me-4-F	
1-253	CHMeCH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> NHEt	3-I	2-Me-4-Cl	
1-254	CHMeCH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> NHEt	3-I	2-Me-4-Br	
1-255	CHMeCH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> NHEt	3-I	2-Me-4-I	
1-256	CHMeCH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> NHEt	3-I	2-Me-3-F-4-Cl	
1-257	CHMeCH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> NHEt	3-I	2-Me-3-Cl-4-F	
1-258	CHMeCH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> NHEt	3-I	2-Me-3, 4-Cl <sub>2</sub>	
1-259	CHMeCH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> NHEt	3-I	2-Me-3-Cl-4-Br	
1-260	CHMeCH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> NHEt	3-I	2-Me-3-Cl-4-I	
1-261	CHMeCH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> NHEt	3-I	2, 4-Cl <sub>2</sub>	
1-262	CHMeCH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> NHEt	3-I	2-Cl-4-Br	
1-263	CHMeCH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> NHEt	3-I	2-Cl-4-I	
1-264	CHMeCH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> NHEt	3-I	2, 4-Br <sub>2</sub>	
1-265	CHMeCH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> NHEt	3-I	2-Br-4-I	
1-266	CHMeCH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> NHEt	3-I	2, 3, 4-Cl <sub>3</sub>	アモルファス
1-267	CHMeCH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> NEt <sub>2</sub>	3-I	2, 3, 4-Cl <sub>3</sub>	114-118
1-268	CMe <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> NEt <sub>2</sub>	3-I	2, 3, 4-Cl <sub>3</sub>	164-166
1-269	CHMeCH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> NHEt	3-I	2, 3-Cl <sub>2</sub> -4-F	
1-270	CHMeCH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> NHEt	3-I	2, 3-Cl <sub>2</sub> -4-Br	
1-271	CHMeCH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> NHEt	3-I	2, 3-Cl <sub>2</sub> -4-I	
1-272	CHMeCH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> NHEt	3-I	2, 4-Cl <sub>2</sub> -3-Br	

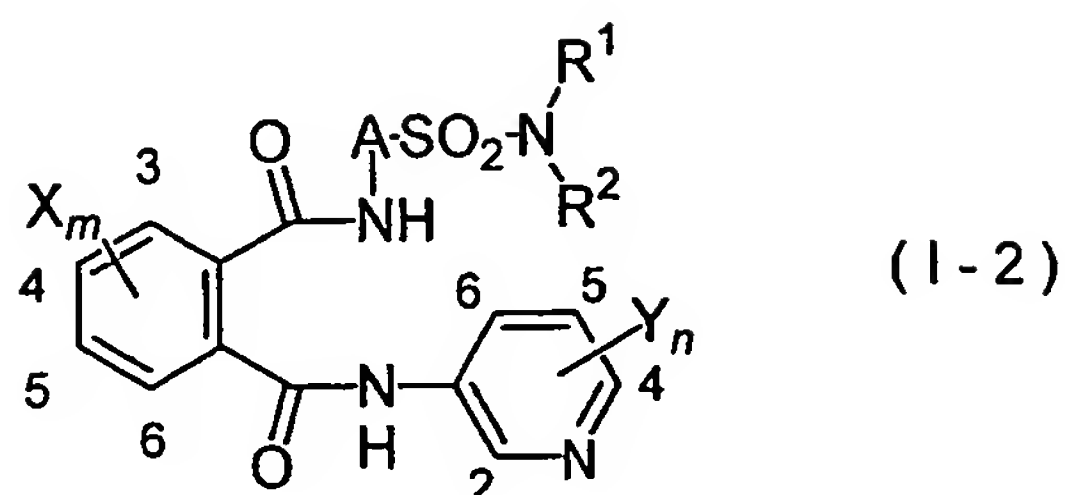
No	-A-SO <sub>2</sub> NR <sup>1</sup> R <sup>2</sup>	X <sub>m</sub>	Y <sub>n</sub>	物性 融点℃
1-273	CHMeCH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> NHEt	3-I	2,4-Cl <sub>2</sub> -3-F	
1-274	CHMeCH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> NHEt	3-I	2-Me-4-OCF <sub>2</sub>	
1-275	CHMeCH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> NHEt	3-I	2-Me-4-OCF <sub>3</sub>	181-182
1-276	CHMeCH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> NEt <sub>2</sub>	3-I	2-Me-4-OCF <sub>3</sub>	アモルファス
1-277	CMe <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> NEt <sub>2</sub>	3-I	2-Me-4-OCF <sub>3</sub>	アモルファス
1-278	CHMeCH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> NHEt	3-I	2-Me-4-OCF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	
1-279	CHMeCH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> NHEt	3-I	2-Me-4-OCF <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub>	
1-280	CHMeCH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> NHEt	3-I	2-Me-4-OCF <sub>2</sub> CHFCF <sub>3</sub>	
1-281	CHMeCH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> NHEt	3-I	2-Me-4-OCF <sub>2</sub> CHFOCF <sub>3</sub>	
1-282	CHMeCH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> NHEt	3-I	2-Me-4-OCF <sub>2</sub> CHFOC <sub>3</sub> F <sub>7-n</sub>	
1-283	CHMeCH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> NHEt	3-I	2-Cl-4-OCF <sub>2</sub>	
1-284	CHMeCH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> NHEt	3-I	2-Cl-4-OCF <sub>3</sub>	
1-285	CHMeCH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> NEt <sub>2</sub>	3-I	2-Cl-4-OCF <sub>3</sub>	100-103
1-286	CMe <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> NEt <sub>2</sub>	3-I	2-Cl-4-OCF <sub>3</sub>	141-142
1-287	CHMeCH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> NHEt	3-I	2-Cl-4-OCF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	
1-288	CHMeCH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> NHEt	3-I	2-Cl-4-OCF <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub>	
1-289	CHMeCH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> NHEt	3-I	2-Cl-4-OCF <sub>2</sub> CHFCF <sub>3</sub>	
1-290	CHMeCH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> NHEt	3-I	2-Cl-4-OCF <sub>2</sub> CHFOCF <sub>3</sub>	
1-291	CHMeCH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> NHEt	3-I	2-Cl-4-OCF <sub>2</sub> CHFOC <sub>3</sub> F <sub>7-n</sub>	
1-292	CHMeCH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> NHEt	3-I	2,3-Cl <sub>2</sub> -4-OCF <sub>3</sub>	
1-293	CHMeCH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> NHEt	3-I	2,3-Cl <sub>2</sub> -4-OCF <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub>	
1-294	CHMeCH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> NHEt	3-I	2,3-Cl <sub>2</sub> -4-OCF <sub>2</sub> CHFCF <sub>3</sub>	
1-295	CHMeCH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> NHEt	3-I	2,3-Cl <sub>2</sub> -4-OCF <sub>2</sub> CHFOCF <sub>3</sub>	
1-296	CHMeCH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> NHEt	3-I	2,3-Cl <sub>2</sub> -4- OCF <sub>2</sub> CHFOC <sub>3</sub> F <sub>7-n</sub>	
1-297	CHMeCH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> NHEt	3-I	4-CF <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	
1-298	CHMeCH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> NHEt	3-I	4-CF(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	
1-299	CHMeCH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> NHEt	3-I	2-Me-4-CF <sub>3</sub>	

No	-A-SO <sub>2</sub> NR <sup>1</sup> R <sup>2</sup>	X <sub>m</sub>	Y <sub>n</sub>	物性 融点℃
1-300	CHMeCH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> NHEt	3-I	2-Me-4-CF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	
1-301	CHMeCH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> NEt <sub>2</sub>	3-I	2-Me-4-CF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	118-120
1-302	CMe <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> NEt <sub>2</sub>	3-I	2-Me-4-CF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	アモルファス
1-303	CMe <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> NHCH <sub>2</sub> Ph	3-I	2-Me-4-CF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	153-154
1-304	CMe <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> NHCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SMe	3-I	2-Me-4-CF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	164-166
1-305	CMe <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> NHCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SOMe	3-I	2-Me-4-CF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	150-152
1-306	CMe <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> NHCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> Me	3-I	2-Me-4-CF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	139-142
1-307	CMe <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> NHCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SEt	3-I	2-Me-4-CF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	159-160
1-308	CMe <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> NHCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SOEt	3-I	2-Me-4-CF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	198-199
1-309	CMe <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> NHCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> Et	3-I	2-Me-4-CF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	133-134
1-310	CMe <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> NHCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SPh	3-I	2-Me-4-CF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	144-145
1-311	CHMeCH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> NHEt	3-I	2-Me-4-CF <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	
1-312	CHMeCH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> NHEt	3-I	2-Cl-4-CF <sub>3</sub>	
1-313	CHMeCH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> NHEt	3-I	2-F-4-CF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	
1-314	CHMeCH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> NHEt	3-I	2-Cl-4-CF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	
1-315	CHMeCH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> NHEt	3-I	2-Cl-4-CF <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	
1-316	CHMeCH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> NHEt	3-I	2-F-4-CF(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	
1-317	CHMeCH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> NHEt	3-I	2-Cl-4-CF(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	
1-318	CHMeCH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> NHEt	3-I	2-Br-4-CF(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	
1-319	CHMeCH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> NHEt	3-I	2-I-4-CF(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	
1-320	CHMeCH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> NHEt	3-I	2-Et-4-CF(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	
1-321	CHMeCH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> NHEt	3-I	2-n-Pr-4-CF(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	
1-322	CHMeCH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> NHEt	3-I	2-i-Pr-4-CF(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	
1-323	CHMeCH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> NHEt	3-I	2-t-Bu-4-CF(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	
1-324	CHMeCH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> NHEt	3-I	2-Ph-4-CF(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	
1-325	CHMeCH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> NHEt	3-I	2-CH <sub>2</sub> OH-4-CF(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	
1-326	CHMeCH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> NHEt	3-I	2-CH <sub>2</sub> OMe-4-CF(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	
1-327	CHMeCH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> NHEt	3-I	2-OMe-4-CF(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	
1-328	CHMeCH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> NHEt	3-I	2-SMe-4-CF(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	



N o	-A-SO <sub>2</sub> NR <sup>1</sup> R <sup>2</sup>	X <sub>m</sub>	Y <sub>n</sub>	物性 融点℃
1-329	CHMeCH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> NHEt	3-I	2-N(Me) <sub>2</sub> -4-CF(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	
1-330	CHMeCH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> NHEt	3-I	2-NO <sub>2</sub> -4-CF(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	
1-331	CHMeCH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> NHEt	3-I	2-CF <sub>3</sub> -4-CF(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	
1-332	CHMeCH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> NHEt	3-I	2-CHO-4-CF(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	
1-333	CHMeCH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> NHEt	3-I	2-CN-4-CF(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	
1-334	CHMeCH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> NHEt	3-I	2-COMe-4-CF(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	
1-335	CHMeCH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> NHEt	3-I	2,3-(Me) <sub>2</sub> -4-CF(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	
1-336	CHMeCH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> NHEt	3-I	2-Me-3-F-4-CF(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	
1-337	CHMeCH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> NHEt	3-I	2-Me-3-Cl-4-CF(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	
1-338	CHMeCH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> NHEt	3-I	2-Me-3-OH-4-CF(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	
1-339	CHMeCH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> NHEt	3-I	2-Me-3-OMe-4-CF(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	
1-340	CHMeCH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> NHEt	3-I	2-Me-5-F-4-CF(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	
1-341	CHMeCH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> NHEt	3-I	2-Me-5-Cl-4-CF(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	
1-342	CHMeCH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>	3-I	2-Me-4-CH(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	214-216
1-343	CHMeCH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> NHEt	3-I	2-Me-4-CH(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	232-234
1-344	CMe <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> NEt <sub>2</sub>	3-I	2-Me-4-CH(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	アモルファス
1-345	CMe <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> N(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub>	3-I	2-Me-4-CH(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	アモルファス
1-346	CHMeCH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> NHEt	3-I	2-Me-4-C(OH)(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	
1-347	CHMeCH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> NHEt	3-I	2-Me-4-C(OMe)(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	
1-348	CHMeCH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> NHEt	3-I	2-Me-4-C(OEt)(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	
1-349	CHMeCH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> NHEt	3-I	2-OCF <sub>2</sub> O-3-4-CF(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	
1-350	CHMeCH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> NHEt	3-I	2-OCH <sub>2</sub> O-3-4-CF(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	
1-351	CHMeCH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> NHEt	3-I	2-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -3-4-CF(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	
1-352	CHMeCH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> NHEt	3-I	2-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -3-4-CF(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	
1-353	CHMeCH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> NHEt	3-I	2-Me-4-CF(CF <sub>3</sub> )CF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	

一般式 (I-2)



第2表

No	-A-SO <sub>2</sub> NR <sup>1</sup> R <sup>2</sup>	X <sub>m</sub>	Y <sub>n</sub>	物性 融点℃
2-1	CHMeCH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> NHEt	3-I	4-CF(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	
2-2	CHMeCH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>	3-I	2-Me-4-CF(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	
2-3	CHMeCH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> NHMe	3-I	2-Me-4-CF(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	
2-4	CHMeCH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> NMe <sub>2</sub>	3-I	2-Me-4-CF(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	
2-5	CHMeCH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> NHEt	3-I	2-Me-4-CF(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	アモルファス
2-6	CHMeCH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> NEt <sub>2</sub>	3-I	2-Me-4-CF(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	
2-7	CMe <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> NEt <sub>2</sub>	3-I	2-Me-4-CF(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	アモルファス
2-8	CHMeCH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> NHEt	3-I	2-Cl-4-CF(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	
2-9	CHMeCH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> NHEt	3-I	2-OMe-4-CF(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	
2-10	CHMeCH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> NHEt	3-I	2-SMe-4-CF(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	
2-11	CHMeCH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> NHEt	3-I	2-SOMe-4-CF(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	
2-12	CHMeCH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> NHEt	3-I	2-SO <sub>2</sub> Me-4-CF(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	
2-13	CHMeCH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> NHEt	3-I	2-Et-4-CF(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	
2-14	CHMeCH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> NHEt	3-I	2-n-Pr-4-CF(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	
2-15	CHMeCH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> NHEt	3-I	4-CH(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	
2-16	CHMeCH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> NHEt	3-I	2-Me-4-CH(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	アモルファス
2-17	CHMeCH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> NHEt	3-I	2-Cl-4-CH(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	
2-18	CHMeCH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> NHEt	3-I	2-OMe-4-CH(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	
2-19	CHMeCH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> NHEt	3-I	2-SMe-4-CH(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	
2-20	CHMeCH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> NHEt	3-I	2-SOMe-4-CH(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	
2-21	CHMeCH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> NHEt	3-I	2-SO <sub>2</sub> Me-4-CH(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	
2-22	CHMeCH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> NHEt	3-I	2-Et-4-CH(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	

No	-A-SO <sub>2</sub> NR <sup>1</sup> R <sup>2</sup>	X <sub>m</sub>	Y <sub>n</sub>	物性 融点℃
2-23	CHMeCH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> NHEt	3-I	2-n-Pr-4-CH(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	

第1表及び第2表中、物性がアモルファスで示される化合物の<sup>1</sup>H-NMRデータを第3表に示す。

第3表

No.	NMRデータ <sup>1</sup> H-NMR[CDCl <sub>3</sub> (or DMSO-d <sub>6</sub> )/TMS, δ 値(ppm)]
1-62 (CDCl <sub>3</sub> )	1.30(d, 3H), 1.60(s, 6H), 2.38(s, 3H), 2.80(m, 2H), 3.30(m, 3H), 3.43(s, 2H), 4.00(m, 1H), 4.50(m, 1H), 6.45(br, 1H), 7.25(m, 1H), 7.48(m, 2H), 7.76(d, 1H), 7.98(d, 1H), 8.29(d, 1H), 8.40(br, 1H)
1-147 (CDCl <sub>3</sub> )	1.09(d, 3H), 1.44(d, 3H), 2.05(s, 3H), 2.37(s, 3H), 2.43(m, 2H), 3.32(m, 2H), 3.63(m, 1H), 4.63(m, 1H), 5.46(br, 1H), 6.70(br, 1H), 7.21(t, 1H), 7.36(d, 1H), 7.44(s, 1H), 7.70(d, 1H), 7.90(m, 2H), 8.64(br, 1H)
1-149 (CDCl <sub>3</sub> )	1.19(d, 3H), 1.37(d, 3H), 2.33(s, 3H), 2.83(s, 3H), 3.52(m, 2H), 3.27(d, 2H), 3.98(m, 1H), 4.55(m, 1H), 5.98(br, 1H), 6.88(br, 1H), 7.11(t, 1H), 7.33(d, 1H), 7.42(s, 1H), 7.60(m, 1H), 7.83(m, 2H), 8.89(br, 1H)
1-175 (DMSO-d <sub>6</sub> )	1.49(s, 6H), 2.35(s, 3H), 3.65(s, 2H), 6.91(br, 2H), 7.25(m, 1H), 7.51(d, 1H), 7.52(s, 1H), 7.70(d, 1H), 7.78(d, 1H), 7.99(d, 1H), 8.29(s, 1H), 9.87(br, 1H)
1-176 (CDCl <sub>3</sub> )	1.63(s, 6H), 2.39(s, 3H), 2.56(d, 3H), 3.41(s, 2H), 4.21(br, 1H), 6.48(br, 1H), 7.20(m, 1H), 7.47(m, 2H), 7.74(d, 1H), 7.99(d, 1H), 8.30(br, 1H), 8.32(d, 1H)
1-178 (CDCl <sub>3</sub> )	1.01(t, 3H), 1.61(s, 6H), 2.38(s, 3H), 2.98(q, 2H), 3.40(s, 2H), 4.52(br, 1H), 6.63(br, 1H), 7.19(m, 1H), 7.43(m, 2H), 7.71(d, 1H), 7.95(d, 1H), 8.21(d, 1H), 8.46(br, 1H)
1-179 (CDCl <sub>3</sub> )	1.08(t, 6H), 1.61(s, 6H), 2.34(s, 3H), 3.12(q, 4H), 3.21(s, 2H), 6.75(br, 1H), 7.20(m, 1H), 7.43(m, 2H), 7.75(d, 1H), 7.96(d, 1H), 8.37(d, 1H), 8.50(br, 1H)
1-266 (DMSO-d <sub>6</sub> )	1.00(t, 3H), 1.28(d, 3H), 2.84(m, 4H), 4.27(m, 1H), 7.14(br, 1H), 7.28(m, 1H), 7.67(m, 3H), 8.03(d, 1H), 8.52(d, 1H), 10.14(br, 1H)

1-276 (CDCl <sub>3</sub> )	1. 10 (t, 6H), 1. 46 (d, 3H), 2. 31 (s, 3H), 3. 15 (m, 5H), 3. 67 (m, 1H), 4. 60 (m, 1H), 6. 80 (br, 1H), 7. 04 (s, 1H), 7. 21 (t, 1H), 7. 25 (d, 1H), 7. 74 (d, 1H), 7. 95 (d, 1H), 8. 01 (d, 1H), 8. 26 (br, 1H)
1-277 (CDCl <sub>3</sub> )	1. 11 (t, 6H), 1. 63 (s, 6H), 2. 33 (s, 3H), 3. 14 (q, 4H), 3. 20 (s, 2H), 6. 67 (br, 1H), 7. 12 (d, 1H), 7. 21 (m, 2H), 7. 77 (d, 1H), 7. 97 (d, 1H), 8. 18 (d, 1H), 8. 30 (br, 1H)
1-302 (CDCl <sub>3</sub> )	1. 10 (t, 6H), 1. 62 (s, 6H), 2. 38 (s, 3H), 3. 12 (q, 4H), 3. 16 (s, 2H), 6. 68 (br, 1H), 7. 22 (m, 1H), 7. 43 (m, 2H), 7. 79 (d, 1H), 7. 99 (d, 1H), 8. 43 (br, 1H), 8. 45 (d, 1H)
1-344 (CDCl <sub>3</sub> )	1. 09 (t, 6H), 1. 62 (s, 6H), 2. 35 (s, 3H), 3. 13 (q, 4H), 3. 20 (s, 2H), 3. 99 (m, 1H), 6. 63 (br, 1H), 7. 26 (m, 3H), 7. 78 (d, 1H), 7. 98 (d, 1H), 8. 33 (d, 1H), 8. 35 (br, 1H)
1-345 (CDCl <sub>3</sub> )	1. 63 (s, 6H), 1. 78 (m, 4H), 2. 35 (s, 3H), 3. 19 (m, 4H), 3. 26 (s, 2H), 3. 99 (m, 1H), 6. 68 (br, 1H), 7. 23 (m, 3H), 7. 77 (d, 1H), 7. 98 (d, 1H), 8. 31 (d, 1H), 8. 33 (br, 1H)
2-5 (CDCl <sub>3</sub> )	1. 05 (t, 3H), 1. 47 (d, 3H), 2. 59 (s, 3H), 3. 05 (m, 2H), 3. 25 (d, 2H), 4. 50 (m, 1H), 5. 05 (br, 1H), 6. 65 (br, 1H), 7. 25 (m, 1H), 7. 45 (d, 1H), 7. 73 (d, 1H), 7. 97 (d, 1H), 8. 33 (d, 1H), 8. 63 (br, 1H)
2-7 (CDCl <sub>3</sub> )	1. 08 (t, 6H), 1. 63 (s, 6H), 2. 62 (s, 3H), 3. 12 (q, 4H), 3. 18 (s, 2H), 6. 79 (br, 1H), 7. 22 (m, 1H), 7. 53 (d, 1H), 7. 77 (d, 1H), 7. 98 (d, 1H), 8. 73 (d, 1H), 8. 78 (br, 1H)
2-16 (CDCl <sub>3</sub> )	1. 01 (t, 3H), 1. 46 (d, 3H), 2. 55 (s, 3H), 3. 03 (m, 2H), 3. 24 (d, 2H), 4. 40 (m, 2H), 5. 10 (br, 1H), 6. 65 (br, 1H), 7. 25 (m, 2H), 7. 71 (d, 1H), 7. 93 (d, 1H), 8. 14 (d, 1H), 8. 74 (br, 1H)

## 実施例

以下に本発明の代表的な実施例を例示するが、本発明はこれらに限定されるものではない。

### 5 実施例 1.

N<sup>2</sup> - (2 - エチルスルファモイル - 1 - メチルエチル) - 3 - ヨード - N<sup>1</sup> - {2 - メチル - 4 - [1, 2, 2, 2 - テトラフルオロ - 1 - (トリフルオロメチル) エチル] フェニル} フタルアミド (化合物No. 1 - 4) の製造

(1 - 1) . 2 - アミノプロパノール 22.53 g (300 mmol) をテトラ  
 10 ヒドロフラン (500 ml) に溶かし、氷冷下、カルボベンゾキシクロリドの 3  
 0% トルエン溶液 155.1 g (300 mmol)、トリエチルアミン 36.43

g (360 mmol) のテトラヒドロフラン溶液を順次、ゆっくりと滴下した。室温で3時間攪拌後、析出してきたトリエチルアミンの塩酸塩を減圧濾過、酢酸エチルで洗浄した。濾液を減圧濃縮した後、希塩酸を加え、酢酸エチルで3回抽出した。有機層を飽和重曹水、飽和食塩水で順次洗浄し、無水硫酸ナトリウムで乾燥後、溶媒を留去して(2-ヒドロキシ-1-メチルエチル)カルバミン酸ベンジルを49.8 g (収率79%) 得た。

(1-2) . (2-ヒドロキシ-1-メチルエチル)カルバミン酸ベンジル46.5 g (222 mmol)、トリエチルアミン26.96 g (266 mmol) をテトラヒドロフラン(400 ml) に溶かし、0℃でメタンスルホンクロリド27.96 g (244 mmol) のテトラヒドロフラン溶液をゆっくりと滴下した。室温で5時間攪拌後、析出してきたトリエチルアミンの塩酸塩を減圧濾過、酢酸エチルで洗浄した。濾液を減圧濃縮した後、水を加え、酢酸エチルで3回抽出し、飽和重曹水、飽和食塩水で順次洗浄、無水硫酸ナトリウムで乾燥した。溶媒を留去して得た粗結晶を溶媒(ヘキサン：酢酸エチル=4：1) で2回洗浄して、メタンスルホン酸2-(ベンジルオキシカルボニルアミノ)プロピルを49.5 g (収率78%) 得た。

(1-3) . メタンスルホン酸2-(ベンジルオキシカルボニルアミノ)プロピル34.9 g (120 mmol) をエタノール(120 ml) に溶かし、チオグリコール酸14.42 g (120 mmol) とナトリウムエトキシド(120 mmol) のエタノール溶液から別途調製したチオラートを滴下した。室温で30分間、50℃で2時間反応後、溶媒を留去し、残渣に水を加えて酢酸エチルで3回抽出し、飽和重曹水、飽和食塩水で順次洗浄、無水硫酸ナトリウムで乾燥した。溶媒を留去して得た残渣をシリカゲルのカラムクロマトグラフィー(ヘキサン：酢酸エチル=4：1) で精製して、2-(ベンジルオキシカルボニルアミノ)プロピルチオ酢酸を34.5 g (収率92%) 得た。

(1-4) . 2-(ベンジルオキシカルボニルアミノ)プロピルチオ酢酸34.5 g (110 mmol) を酢酸エチル(150 ml) に溶かし、0℃でメタクロロ過安息香酸23.9 g (110 mmol) の酢酸エチル溶液(50 ml) をゆっくりと滴下した。室温で3時間反応後、反応溶液を飽和重曹水中に注ぎ、酢酸



エチルで抽出、飽和重曹水で3回、飽和食塩水で順次洗浄、無水硫酸ナトリウムで乾燥した。溶媒を留去して得た粗結晶を溶媒（ヘキサン：酢酸エチル＝2：1）で2回洗浄して、2-（ベンジルオキシカルボニルアミノ）プロピルスルフィニル酢酸を30.38 g（収率84%）得た。

- 5   （1-5）. 2-（ベンジルオキシカルボニルアミノ）プロピルスルフィニル酢酸30.38 g（93 mmol）をメタノール（300 ml）に懸濁させ、ヨウ素19.04 g（75 mmol）を加え、還流下5時間反応させた。反応混合物に亜硫酸水素ナトリウム水溶液を加えて、過剰のヨウ素を還元した後、飽和重曹水と重曹を加えて溶液を弱塩基性とし、メタノールを留去した。残渣に水を加えて酢酸エチルで3回抽出、飽和食塩水で洗浄、無水硫酸ナトリウムで乾燥した。

- 10   溶媒を留去して得た粗製のビス[2-（ベンジルオキシカルボニルアミノ）プロピル]ジスルフィド（29 mmol、<sup>1</sup>H-NMR積分比より概算）をエタノール（150 ml）に懸濁させ、N-ブromoコハク酸イミド15.66 g（88 mmol）を少量ずつ加えた。室温で3時間反応後、飽和重曹水と重曹を加えて溶液を弱塩基性とし、エタノールを留去した。残渣に水を加えて酢酸エチルで3回抽出、水で3回、飽和食塩水で順次洗浄、無水硫酸ナトリウムで乾燥した。溶媒を留去して得た残渣をシリカゲルのカラムクロマトグラフィー（ヘキサン：酢酸エチル＝2：1）で精製して、2-（ベンジルオキシカルボニルアミノ）プロパン-1-スルフィン酸エチルを16.0 g（収率60%）得た。

- 20   （1-6）. 2-（ベンジルオキシカルボニルアミノ）プロパン-1-スルフィン酸エチル2.2 g（7.4 mmol）をエタノール（7 ml）に溶かし、氷冷下10%水酸化ナトリウム水溶液3.2 g（8 mmol）をゆっくりと滴下した。室温で1時間反応後、エタノールを留去し、残渣に水を加えてメチルターシャリーブチルエーテルで2回抽出し、水層を濃塩酸で酸性として、酢酸エチルで3回抽出、飽和食塩水で洗浄、無水硫酸ナトリウムで乾燥した。溶媒を留去して得た粗結晶を溶媒（ヘキサン：酢酸エチル＝4：1）で2回洗浄して、2-（ベンジルオキシカルボニルアミノ）プロパン-1-スルフィン酸を1.73 g（収率91%）得た。

（1-7）. 炭酸カリウム0.52 g（3.8 mmol）を水（10 ml）に溶か

し、2-（ベンジルオキシカルボニルアミノ）プロパン-1-スルフィン酸1.73 g（6.7 mmol）を加えた後、臭素1.07 g（6.7 mmol）を滴下した（滴下途中での結晶が析出して攪拌が困難になってくるため、適宜水を加えた）。室温で30分間攪拌後、結晶を濾過し、水で洗浄して、2-（ベンジルオキシカルボニルアミノ）プロパン-1-スルホンブロミドを2.30 g（定量的）得た。

（1-8）. 70%エチルアミン水溶液（10 ml）に氷冷下、2-（ベンジルオキシカルボニルアミノ）プロパン-1-スルホンブロミド1.44 g（3.3 mmol）のテトラヒドロフラン溶液（5 ml）を滴下した。室温で1時間反応させた後、反応混合物を希塩酸中に注ぎ、酢酸エチルで3回抽出、飽和食塩水で洗浄、無水硫酸ナトリウムで乾燥した。溶媒を留去して得た粗製のN-エチル-2-（ベンジルオキシカルボニルアミノ）プロパン-1-スルホンアミドをそのまま次の反応に用いた。

（1-9）. 10% Pd-C 0.07 gをアルゴン置換した加圧水添用ボトルに入れ、エタノール（10 ml）を一気に加えて懸濁させた後、（1-8）で得た粗製のN-エチル-2-（ベンジルオキシカルボニルアミノ）プロパン-1-スルホンアミドのエタノール溶液（20 ml）を加えて、加圧下（水素圧4 Kg/cm<sup>2</sup>）10時間反応させた（途中、発生する一酸化炭素の分圧を下げるため、圧を下げ、再び加圧した）。反応溶液をセライト濾過、エタノールで洗浄し、濾液を減圧濃縮して得た結晶を溶媒（ヘキサン：酢酸エチル=2：1）で2回洗浄して、N-エチル-2-アミノプロパン-1-スルホンアミドを0.27 g {2-（ベンジルオキシカルボニルアミノ）プロパン-1-スルホンブロミドから収率50%} 得た。

（1-10）. 3-ヨード無水フタル酸5.5 g（20 mmol）をアセトニトリル（100 ml）に溶かし、2-メチル-4-〔1,2,2,2-テトラフルオロ-1-（トリフルオロメチル）エチル〕アニリン5.5 g（20 mmol）のアセトニトリル溶液（20 ml）をゆっくりと滴下した。室温で3時間攪拌後、減圧下にアセトニトリルの2/3量を留去し、析出した結晶を濾過、アセトニトリルで洗浄し、6-ヨード-N-〔2-メチル-4-〔1,2,2,2-テトラフ

ルオロー1- (トリフルオロメチル) エチル] フェニル} フタルアミド酸を5.6 g (収率51%) 得た。

(1-11) . 6-ヨード-N- {2-メチル-4- [1, 2, 2, 2-テトラフルオロー1- (トリフルオロメチル) エチル] フェニル} フタルアミド酸5.47 g (10 mmol) をメチルターシャリーブチルエーテル (60 ml) に懸濁させ、無水トリフルオロ酢酸3.15 g (15 mmol) のメチルターシャリーブチルエーテル溶液をゆっくりと滴下した。室温で3時間攪拌後、氷水中に注ぎ、酢酸エチルで3回抽出、飽和重曹水で2回、飽和食塩水で1回洗浄後、無水硫酸ナトリウムで乾燥した。溶媒を留去して得た粗結晶を溶媒 (ヘキサン : 酢酸エチル=4 : 1) で2回洗浄して、1, 3-ジヒドロ-7-ヨード-3- {2-メチル-4- [1, 2, 2, 2-テトラフルオロー1- (トリフルオロメチル) エチル] フェニルイミノ} -2-ベンゾフラン-1-オンを5.0 g (収率94%) 得た。

(1-12) . 1, 3-ジヒドロ-7-ヨード-3- {2-メチル-4- [1, 2, 2, 2-テトラフルオロー1- (トリフルオロメチル) エチル] フェニルイミノ} -2-ベンゾフラン-1-オン0.42 g (0.8 mmol) をアセトニトリル (10 ml) に溶かし、(1-9) で得たN-エチル-2-アミノプロパン-1-スルホンアミド0.13 g (0.8 mmol) を加え、室温で10時間反応させた。溶媒を留去し、析出した結晶を濾過、アセトニトリルで洗浄後、混合溶媒 (ヘキサン : 酢酸エチル=4 : 1) で更に洗浄し、N<sup>2</sup>- (2-エチルスルファモイル-1-メチルエチル) -3-ヨード-N<sup>1</sup>- {2-メチル-4- [1, 2, 2, 2-テトラフルオロー1- (トリフルオロメチル) エチル] フェニル} フタルアミドを0.45 g (収率81%) 得た。

融点 : 170 ~ 172 °C

## 25 実施例2.

3-ヨード-N<sup>1</sup>- {2-メチル-4- [1, 2, 2, 2-テトラフルオロー1- (トリフルオロメチル) エチル] フェニル} -N<sup>2</sup>- (2-スルファモイル-1, 1-ジメチルエチル) フタルアミド (化合物No. 1-175) の製造  
(2-1) . 1, 1-ジメチル-2- (メチルチオ) エチルアミン23.86 g

(200 mmol) をテトラヒドロフラン (300 ml) に溶かし、氷冷下、カルボベンゾキシクロリドの30%トルエン溶液103.4 g (200 mmol)、トリエチルアミン24.29 g (240 mmol) のテトラヒドロフラン溶液を順次、ゆっくりと滴下した。室温で3時間攪拌後、析出してきたトリエチルアミンの塩酸塩を減圧濾過、酢酸エチルで洗浄した。濾液を減圧濃縮した残渣をシリカゲルのカラムクロマトグラフィー (ヘキサン：酢酸エチル=4：1) で精製して、1,1-ジメチル-2-(メチルチオ)エチルカルバミン酸ベンジルを36.35 g (収率72%) 得た。

(2-2). 1,1-ジメチル-2-(メチルチオ)エチルカルバミン酸ベンジル45.4 g (179 mmol) の含水メタノール溶液 (メタノール150 ml に水5.22 g (290 mmol) を加えたもの) に攪拌しながらN-ブromoコハク酸イミド33.46 g (188 mmol) を少量ずつ加えた。室温で2時間反応後、飽和重曹水で反応溶液を弱塩基性とした後、メタノールを留去した。残渣に水を加え、酢酸エチルで3回抽出し、水で3回、飽和食塩水で1回洗浄し、無水硫酸ナトリウムで乾燥した。溶媒を留去して得た粗製の1,1-ジメチル-2-(メチルスルフィニル)エチルカルバミン酸ベンジルを無水酢酸 (150 ml) に溶かし、還流下4時間反応させた。過剰の無水酢酸および酢酸を減圧下に留去し、粗製の酢酸[2-(ベンジルオキシカルボニルアミノ)-2-メチルプロピル]チオメチルを含有する残渣を得た。この残渣をメタノール (300 ml) に溶かし、ヨウ素19.54 g (77 mmol) を加え、還流下5時間反応させた。反応混合物を室温まで冷却後、亜硫酸水素ナトリウム水溶液を加えて過剰のヨウ素を還元し、飽和重曹水で反応溶液を弱塩基性とした後、メタノールを留去した。残渣に水を加え、酢酸エチルで3回抽出、飽和食塩水で洗浄、無水硫酸ナトリウムで乾燥した。溶媒を留去して得た残渣をシリカゲルのカラムクロマトグラフィー (ヘキサン：酢酸エチル=4：1) で精製して、ビス[2-(ベンジルオキシカルボニルアミノ)-2-メチルプロピル]ジスルフィドを10.0 g (収率23%) 得た。

(2-3). ビス[2-(ベンジルオキシカルボニルアミノ)-2-メチルプロピル]ジスルフィド10.0 g (21 mmol) をエタノール (150 ml) に

溶かし、N-ブロモコハク酸イミド 11.21 g (63 mmol) を攪拌しながら少量ずつ加えた。室温で2時間反応後、飽和重曹水で反応溶液を弱塩基性とした後、エタノールを留去した。残渣に水を加え、酢酸エチルで3回抽出し、水で3回、飽和食塩水で1回洗浄し、無水硫酸ナトリウムで乾燥した。溶媒を留去して得た残渣をシリカゲルのカラムクロマトグラフィー（ヘキサン：酢酸エチル＝2：1）で精製して、2-（ベンジルオキシカルボニルアミノ）-2-メチルプロパン-1-スルフィン酸エチルを 10.45 g（収率83%）得た。

(2-4). 2-（ベンジルオキシカルボニルアミノ）-2-メチルプロパン-1-スルフィン酸エチル 0.60 g (2 mmol) をエタノール (10 ml) に溶かし、氷冷下 10%水酸化ナトリウム水溶液 0.9 g (2.2 mmol) をゆっくりと滴下した。室温で1時間反応後、エタノールを留去し、残渣に水 (10 ml)、酢酸ナトリウム 0.18 g (2.2 mmol)、ヒドロキシルアミン-O-スルホン酸 0.25 g (2.2 mmol) を加え、室温で1時間反応させた。反応混合物を水中に注ぎ、酢酸エチルで3回抽出、飽和重曹水、飽和食塩水で順次洗浄、無水硫酸ナトリウムで乾燥した。溶媒を留去して得た粗製の2-（ベンジルオキシカルボニルアミノ）-2-メチルプロパン-1-スルホンアミド 0.49 g（収率86%）をそのまま次の反応に用いた。

(2-5). 10% Pd-C 0.20 g をアルゴン置換した加圧水添用ボトルに入れ酢酸 (5 ml) を一気に加えて懸濁させた後、(2-4) で得た2-（ベンジルオキシカルボニルアミノ）-2-メチルプロパン-1-スルホンアミドの酢酸溶液 (10 ml) を加えて、加圧下（水素圧  $4 \text{ Kg/cm}^2$ ）10時間反応させた（途中、発生する一酸化炭素の分圧を下げるため、圧を下げ、再び加圧した）。反応溶液をセライト濾過、エタノール洗浄し、濾液を減圧濃縮した残渣（粗製の2-アミノ-2-メチルプロパン-1-スルホンアミド酢酸塩）をそのまま次の反応に用いた。

(2-6). 1, 3-ジヒドロ-7-ヨード-3-〔2-メチル-4-〔1, 2, 2, 2-テトラフルオロ-1-（トリフルオロメチル）エチル〕フェニルイミノ〕-2-ベンゾフラン-1-オン 0.8 g (1.5 mmol) をアセトニトリル (10 ml) に溶かし、(2-5) で得た粗製の2-アミノ-2-メチルプロパ



ンスルホンアミド酢酸塩及びトリエチルアミン0.17g (1.7mmol)を加えて、室温で30時間反応させた。溶媒を留去して得た残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー（ヘキサン：酢酸エチル＝1：1）で精製して、3-ヨード- $N^1$ -{2-メチル-4-[1,2,2,2-テトラフルオロ-1-(トリフルオロメチル)エチル]フェニル}- $N^2$ -(2-スルファモイル-1,1-ジメチルエチル)フタルアミドをアモルファスとして0.05g (収率9%)得た。

$^1\text{H-NMR}$  [DMSO- $d_6$ /TMS,  $\delta$  値(ppm)]

1.49(s, 6H), 2.35(s, 3H), 3.65(s, 2H), 6.91(br, 2H), 7.25(m, 1H), 7.51(d, 1H), 7.52(s, 1H), 7.70(d, 1H), 7.78(d, 1H), 7.99(d, 1H), 8.29(s, 1H), 9.87(br, 1H)

- 10 本発明の一般式(I)で表されるスルホンアミド誘導体又はその塩類を有効成分として含有する農園芸用殺虫剤は水稻、果樹、野菜、その他の作物及び花卉等を加害する各種農林、園芸、貯穀害虫や衛生害虫或いは線虫等の害虫防除に適しており、例えばリンゴコカクモンハマキ (*Adoxophyes orana fasciata*)、チャノコカクモンハマキ (*Adoxophyes* sp.)、リンゴコシンクイ (*Grapholita*
- 15 *inopinata*)、ナシヒメシンクイ (*Grapholita molesta*)、マメシンクイガ (*Leguminivora glycinivorella*)、クワハマキ (*Olethreutes mori*)、チャノホソガ (*Caloptilia thevivor*)、リンゴホソガ (*Caloptilia zachrysa*)、キンモンホソガ (*Phyllonorycter ringoniella*)、ナシホソガ (*Spulerina asturota*)、モンシロチョウ (*Pieris rapae crucivora*)、オオタバコガ類
- 20 (*Heliothis* sp.)、コドリंगा (*Laspeyresia pomonella*)、コナガ (*Plutella xylostella*)、リンゴヒメシンクイ (*Argyresthia conjugella*)、モモシンクイガ (*Carposina niponensis*)、ニカメイガ (*Chilo suppressalis*)、コブノメイガ (*Cnaphalocrocis medinalis*)、チャマダラメイガ (*Ephesia elutella*)、クワノメイガ (*Glyphodes pyralis*)、サンカメイガ
- 25 (*Scirpophaga incertulas*)、イチモンジセセリ (*Parnara guttata*)、アワヨトウ (*Pseudaletia separata*)、イネヨトウ (*Sesamia inferens*)、ハスモンヨトウ (*Spodoptera litura*)、シロイチモジヨトウ (*Spodoptera exigua*)等の鱗翅目害虫、フタテンヨコバイ (*Macrosteles fascifrons*)、ツマグロヨコバイ (*Nephotettix cincticeps*)、トビイロウンカ (*Nilaparvata lugens*)、セジロ

- ウンカ (*Sogatella furcifera*)、ミカンキジラミ (*Diaphorina citri*)、ブドウコナジラミ (*Aleurolobus taonabae*)、タバココナジラミ (*Bemisia tabaci*)、オンシツコナジラミ (*Trialeurodes vaporariorum*)、ニセダイコンアブラムシ (*Lipaphis erysimi*)、モモアカアブラムシ (*Myzus persicae*)、ツノロウムシ (5 *Ceroplastes ceriferus*)、ミカンワタカイガラムシ (*Pulvinaria aurantii*)、ミカンマルカイガラムシ (*Pseudaonidia duplex*)、ナシマルカイガラムシ (*Comstockaspis perniciosus*)、ヤノネカイガラムシ (*Unaspis yanonensis*) 等の半翅目害虫、ヒメコガネ (*Anomala rufocuprea*)、マメコガネ (*Popillia japonica*)、タバコシバンムシ (*Lasioderma serricorne*)、ヒラタキクイムシ (10 *Lyctus brunneus*)、ニジュウヤホシテントウ (*Epilachna vigintiotopunctata*)、アズキゾウムシ (*Callosobruchus chinensis*)、ヤサイゾウムシ (*Listroderes costirostris*)、コクゾウムシ (*Sitophilus zeamais*)、ワタミゾウムシ (*Anthonomus grandis grandis*)、イネミズゾウムシ (*Lissorhoptrus oryzophilus*)、ウリハムシ (*Aulacophora femoralis*)、イネ (15 *Oulema oryzae*)、キスジノミハムシ (*Phyllotreta striolata*)、マツノキクイムシ (*Tomicus piniperda*)、コロラドポテトビートル (*Leptinotarsa decemlineata*)、メキシカンビーンビートル (*Epilachna varivestis*)、コーンルートワーム類 (*Diabrotica* sp.) 等の甲虫目害虫、ウリミバエ (*Dacus (Zeugodacus) cucurbitae*)、ミカンコミバエ (*Dacus (Bactrocera) dorsalis*)、イネハモグリバエ (*Agromyza oryzae*)、タマネギバエ (*Delia antiqua*)、タネバエ (*Delia platura*)、ダイズサヤタマバエ (*Asphondylia* sp.)、イエバエ (*Musca domestica*)、アカイエカ (*Culex pipiens pipiens*) 等の双翅目害虫、ネグサレセンチュウ (*Pratylenchus* sp.)、ミナミネグサレセンチュウ (*Pratylenchus coffeae*)、ジャガイモシストセンチュウ (25 *Globodera rostochiensis*)、ネコブセンチュウ (*Meloidogyne* sp.)、ミカンネセンチュウ (*Tylenchulus semipenetrans*)、ニセネグサレセンチュウ (*Aphelenchus avenae*)、ハガレセンチュウ (*Aphelenchoides ritzemabosi*) 等のハリセンチュウ目害虫、ミカンハダニ (*Panonychus citri*)、リンゴハダニ (*Panonychus ulmi*)、ニセナミハダニ (*Tetranychus cinnabarinus*)、カンザ

ワハダニ (*Tetranychus kanzawai* Kishida)、ナミハダニ (*Tetranychus urticae* Koch)、チャノナガサビダニ (*Acaphylla theae*)、ミカンサビダニ (*Aculops pelekassi*)、チャノサビダニ (*Calacarus carinatus*)、ナシサビダニ (*Epitrimerus pyri*) 等のダニ目害虫等に対して強い殺虫効果を有するものである。

本発明の一般式 (I) で表されるスルホンアミド誘導体又はその塩類を有効成分とする農園芸用殺虫剤は、水田作物、畑作物、果樹、野菜、その他の作物及び花卉等に被害を与える前記害虫に対して顕著な防除効果を有するものであるので、害虫の発生が予測される時期に合わせて、害虫の発生前又は発生が確認された時点で水田、畑、果樹、野菜、その他の作物、花卉等の種子、水田水、茎葉又は土壌に処理することにより本発明の農園芸用殺虫剤の所期の効果が奏せられるものである。

本発明の農園芸用殺虫剤は、農薬製剤上の常法に従い、使用上都合の良い形状に製剤して使用するのが一般的である。

15 即ち、一般式 (I) で表されるスルホンアミド誘導体又はその塩類はこれらを適当な不活性担体に、又は必要に応じて補助剤と一緒に適当な割合に配合して溶解、分離、懸濁、混合、含浸、吸着若しくは付着させ、適宜の剤形、例えば懸濁剤、乳剤、液剤、水和剤、粒剤、粉剤、錠剤、パック剤等に製剤して使用すれば良い。

20 本発明で使用できる不活性担体としては固体又は液体の何れであっても良く、固体の担体になりうる材料としては、例えばダイズ粉、穀物粉、木粉、樹皮粉、鋸粉、タバコ茎粉、クルミ殻粉、ふすま、繊維素粉末、植物エキス抽出後の残渣、粉碎合成樹脂等の合成重合体、粘土類 (例えばカオリン、ベントナイト、酸性白土等)、タルク類 (例えばタルク、ピロフィライト等)、シリカ類 (例えば珪藻土、珪砂、雲母、ホワイトカーボン (含水微粉珪素、含水珪酸ともいわれる合成高分散珪酸で、製品により珪酸カルシウムを主成分として含むものもある。))、活性炭、イオウ粉末、軽石、焼成珪藻土、レンガ粉碎物、フライアッシュ、砂、炭酸カルシウム、磷酸カルシウム等の無機鉱物性粉末、ポリエチレン、ポリプロピレン、ポリ塩化ビニリデン等のプラスチック担体、硫安、燐安、硝安、尿素、

25

塩安等の化学肥料、堆肥等を挙げることができ、これらは単独で若しくは二種以上の混合物の形で使用される。

液体の担体になりうる材料としては、それ自体溶媒能を有するものの他、溶媒能を有さずとも補助剤の助けにより有効成分化合物を分散させうることとなるものから選択され、例えば代表例として次に挙げる担体を例示できるが、これらは単独で若しくは2種以上の混合物の形で使用され、例えば水、アルコール類（例えばメタノール、エタノール、イソプロパノール、ブタノール、エチレングリコール等）、ケトン類（例えばアセトン、メチルエチルケトン、メチルイソブチルケトン、ジイソブチルケトン、シクロヘキサノン等）、エーテル類（例えばエチルエーテル、ジオキサン、セロソルブ、ジプロピルエーテル、テトラヒドロフラン等）、脂肪族炭化水素類（例えばケロシン、鉱油等）、芳香族炭化水素類（例えばベンゼン、トルエン、キシレン、ソルベントナフサ、アルキルナフタレン等）、ハロゲン化炭化水素類（例えばジクロロエタン、クロロホルム、四塩化炭素、塩素化ベンゼン等）、エステル類（例えば酢酸エチル、ジイソブチルフタレート、ジブチルフタレート、ジオクチルフタレート等）、アミド類（例えばジメチルホルムアミド、ジエチルホルムアミド、ジメチルアセトアミド等）、ニトリル類（例えばアセトニトリル等）、ジメチルスルホキシド類等を挙げることができる。

他の補助剤としては次に例示する代表的な補助剤をあげることができ、これらの補助剤は目的に応じて使用され、単独で、ある場合は二種以上の補助剤を併用し、又ある場合には全く補助剤を使用しないことも可能である。

有効成分化合物の乳化、分散、可溶化及び／又は湿潤の目的のために界面活性剤が使用され、例えばポリオキシエチレンアルキルエーテル、ポリオキシエチレンアルキルアリールエーテル、ポリオキシエチレン高級脂肪酸エステル、ポリオキシエチレン樹脂酸エステル、ポリオキシエチレンソルビタンモノラウレート、ポリオキシエチレンソルビタンモノオレエート、アルキルアリールスルホン酸塩、ナフタレンスルホン酸縮合物、リグニンスルホン酸塩、高級アルコール硫酸エステル等の界面活性剤を例示することができる。

又、有効成分化合物の分散安定化、粘着及び／又は結合の目的のために、次に

例示する補助剤を使用することもでき、例えばカゼイン、ゼラチン、澱粉、メチルセルロース、カルボキシメチルセルロース、アラビアゴム、ポリビニルアルコール、松根油、糠油、ベントナイト、リグニンスルホン酸塩等の補助剤を使用することもできる。

- 5 固体製品の流動性改良のために次に挙げる補助剤を使用することもでき、例えばワックス、ステアリン酸塩、燐酸アルキルエステル等の補助剤を使用できる。

懸濁性製品の解こう剤として、例えばナフタレンスルホン酸縮合物、縮合燐酸塩等の補助剤を使用することもできる。

消泡剤としては、例えばシリコーン油等の補助剤を使用することもできる。

- 10 更に必要に応じて機能性展着剤、ピペロニルブトキサイド等の代謝分解阻害剤等の活性増強剤、プロピレングリコール等の凍結防止剤、BHT等の酸化防止剤、紫外線吸収剤等その他の添加剤も加えることが可能である。

- 有効成分化合物の配合割合は必要に応じて加減することができ、農園芸用殺虫剤100重部中、0.01～90重量部の範囲で適宜選択すれば良く、例えば粉  
15 剤或いは粒剤とする場合は0.01から50重量部、又乳剤或いは水和剤とする場合も同様0.01から50重量部が適当である。

本発明の農園芸用殺虫剤は各種害虫を防除するためにそのまま、又は水等で適宜希釈し、若しくは懸濁させた形で病害防除に有効な量を当該害虫の発生が予測される作物若しくは発生が好ましくない場所に適用して使用すれば良い。

- 20 本発明の農園芸用殺虫剤の使用量は種々の因子、例えば目的、対象害虫、作物の生育状況、害虫の発生傾向、天候、環境条件、剤型、施用方法、施用場所、施用時期等により変動するが、有効成分化合物として10アール当たり0.001gから10kg、好ましくは0.01gから1kgの範囲から目的に応じて適宜選択すれば良い。

- 25 本発明の農園芸用殺虫剤は、更に防除対象病虫害、防除適期の拡大のため、或いは薬量の低減をはかる目的で他の農園芸用殺虫剤、殺ダニ剤、殺線虫剤、殺菌剤、生物農薬等と混合して使用することも可能であり、又使用場面に応じて除草剤、植物成長調節剤、肥料等と混合して使用することも可能である。

以下に本発明の代表的な製剤例及び試験例を示すが、本発明はこれらに限定さ



れるものではない。

尚、処方例中、部とあるのは重量部を示す。

製剤例 1.

	第 1 表又は第 2 表記載の化合物	1 0 部
5	キシレン	7 0 部
	N-メチルピロリドン	1 0 部
	ポリオキシエチレンノニルフェニルエーテルと	
	アルキルベンゼンスルホン酸カルシウムとの混合物	1 0 部
	以上を均一に混合溶解して乳剤とする。	

10 製剤例 2.

	第 1 表又は第 2 表記載の化合物	3 部
	クレー粉末	8 2 部
	珪藻土粉末	1 5 部

以上を均一に混合粉砕して粉剤とする。

15 製剤例 3.

	第 1 表又は第 2 表記載の化合物	5 部
	ベントナイトとクレーの混合粉末	9 0 部
	リグニンスルホン酸カルシウム	5 部

以上を均一に混合し、適量の水を加えて混練し、造粒、乾燥して粒剤とする。

20 製剤例 4.

	第 1 表又は第 2 表記載の化合物	2 0 部
	カオリンと合成高分散珪酸の混合物	7 5 部
	ポリオキシエチレンノニルフェニルエーテルと	
	アルキルベンゼンスルホン酸カルシウムとの混合物	5 部

25 以上を均一に混合粉砕して水和剤とする。

試験例 1. コナガ (*Plutella xylostella*) に対する殺虫試験

ハクサイ実生にコナガの成虫を放飼して産卵させ、放飼 2 日後に産下卵の付いたハクサイ実生を第 1 表及び第 2 表記載の化合物を有効成分とする薬剤を 5 0 p p m に希釈した薬液に約 3 0 秒間浸漬し、風乾後に 2 5 °C の恒温室に静置した。

薬液浸漬6日後に孵化虫数を調査し、下記の式により死虫率を算出し、下記基準に従って判定を行った。1区10頭3連制

無処理区孵化虫数－処理区孵化虫数

$$5 \quad \text{補正死虫率 (\%)} = \frac{\text{無処理区孵化虫数} - \text{処理区孵化虫数}}{\text{無処理区孵化虫数}} \times 100$$

判定基準.    A . . . 死虫率100%  
                   B . . . 死虫率99%～90%  
                   C . . . 死虫率89%～80%  
 10               D . . . 死虫率79%～50%  
                   E . . . 死虫率50%以下

上記試験の結果を表4に記す。

試験例2. ハスモンヨトウ (*Spodoptera litura*) に対する殺虫試験

第1表及び第2表記載の化合物を有効成分とする薬剤を50ppmに希釈した  
 15 薬液にキャベツ葉片 (品種: 四季穫) を約30秒間浸漬し、風乾後に直径9cm  
      のプラスチックシャーレに入れ、ハスモンヨトウ2令幼虫を接種した後、蓋をし  
      て25℃の恒温室に静置した。接種8日後に生死虫数を調査し、下記の式により  
      死虫率を算出し、判定基準は試験例1に従って行った。1区10頭3連制。

$$20 \quad \text{補正死虫率 (\%)} = \frac{\text{無処理区生存虫数} - \text{処理区生存虫数}}{\text{無処理区生存虫数}} \times 100$$

補正死虫率 (%) =  $\frac{\text{無処理区生存虫数} - \text{処理区生存虫数}}{\text{無処理区生存虫数}} \times 100$

上記試験の結果を表4に記す。

試験例3. チャノコカクモンハマキ (*Adoxophyes* sp.) に対する殺虫試験

25 第1表及び第2表記載の化合物を有効成分とする薬剤を50ppmに希釈した  
      薬液にチャ葉を約30秒間浸漬し、風乾後に直径9cmのプラスチックシャーレ  
      に入れ、チャノコカクモンハマキ幼虫を接種した後、25℃、湿度70%の恒温  
      室に静置した。接種8日後に生死虫数を調査し、試験例1の判定基準に従って判  
      定を行った。1区10頭3連制。

上記試験の結果を表 4 に記す。

第 4 表

N o	試験例 1	試験例 2	試験例 3
1-1	A	A	A
1-2	A	A	A
1-3	A	A	A
1-4	A	A	A
1-6	A	A	A
1-7	A	A	A
1-8	A	A	A
1-12	A	A	A
1-14	A	A	A
1-20	A	A	A
1-21	A	A	A
1-22	A	A	A
1-23	A	A	A
1-24	A	A	A
1-25	A	A	A
1-27	A	A	A
1-28	A	A	A
1-29	A	A	A
1-30	A	A	A
1-31	A	A	A
1-32	A	A	A
1-35	A	A	A
1-36	A	A	A
1-37	A	A	A
1-38	A	A	A
1-39	A	A	A
1-40	A	A	A

N o	試験例 1	試験例 2	試験例 3
1-41	A	A	A
1-42	A	A	A
1-43	A	A	A
1-44	A	A	A
1-45	A	A	A
1-46	A	A	A
1-47	A	A	A
1-48	A	C	A
1-54	A	A	A
1-55	A	A	A
1-56	A	A	A
1-57	A	A	A
1-58	A	A	E
1-59	A	A	E
1-60	A	A	E
1-61	A	A	A
1-62	A	A	A
1-63	A	A	A
1-66	A	A	A
1-67	A	E	E
1-71	A	A	A
1-72	A	A	A
1-73	A	A	A
1-75	A	A	A
1-76	A	A	A
1-77	A	A	A
1-78	A	E	A
1-79	A	A	A
1-80	A	A	A

No	試験例 1	試験例 2	試験例 3
1-81	A	A	A
1-82	A	A	A
1-83	A	A	A
1-84	A	A	A
1-85	A	A	A
1-86	A	A	A
1-87	A	A	A
1-88	A	A	A
1-89	A	A	A
1-91	A	A	A
1-92	A	A	A
1-93	A	A	A
1-94	A	A	A
1-103	A	A	A
1-104	A	A	A
1-105	A	A	E
1-106	A	E	E
1-107	A	C	A
1-108	A	A	A
1-109	A	E	A
1-110	A	E	E
1-111	A	E	E
1-112	A	E	E
1-116	A	D	A
1-121	A	E	E
1-142	A	A	A
1-144	A	A	A
1-146	A	A	A
1-147	A	A	A

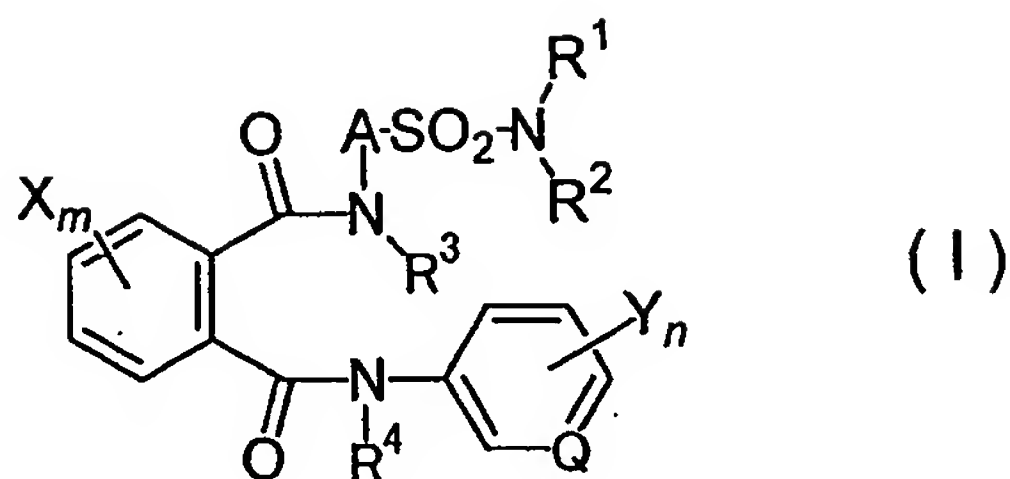


N o	試験例 1	試験例 2	試験例 3
1-148	A	A	A
1-149	A	A	A
1-175	A	A	A
1-176	A	A	A
1-177	A	A	A
1-178	A	A	A
1-179	A	A	A
1-180	A	C	A
1-181	A	A	A
1-184	A	A	A
1-200	A	A	A
1-201	A	A	A
1-207	A	A	E
1-208	A	E	A
1-211	A	A	A
1-212	A	A	A
1-213	A	A	A
1-214	A	A	A
1-215	A	A	A
1-216	A	A	A
1-217	A	A	A
1-218	A	A	A
1-219	A	A	A
1-266	A	C	E
1-267	A	C	E
1-268	A	A	A
1-275	A	E	E
1-276	A	E	E
1-277	A	A	A

N o	試験例 1	試験例 2	試験例 3
1-285	A	C	B
1-286	A	A	E
1-301	A	A	A
1-302	A	A	A
1-303	A	A	A
1-304	A	A	A
1-305	A	A	A
1-306	A	A	A
1-307	A	A	A
1-308	A	A	A
1-309	A	A	A
1-310	A	A	A
1-342	A	A	A
1-343	A	A	A
1-344	A	A	A
1-345	A	A	A
2-5	A	A	A
2-7	A	A	A
2-16	A	E	A

## 請求の範囲

## 1. 一般式 (I)



- 5 {式中、AはC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキレン基、同一又は異なっても良く、ハロゲン原子、シアノ基、ニトロ基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルコキシ基、ハロC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルコキシ基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルチオ基、ハロC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルチオ基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルスルフィニル基、ハロC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルスルフィニル基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルスルホニル基、ハロC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルスルホニル基、モノC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルアミノ基又は同一若しくは異なっても良いジC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルアミノ基から選択される1以上の置換基を有する置換C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキレン基、
- 10 C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>アルケニレン基、同一又は異なっても良く、ハロゲン原子、シアノ基、ニトロ基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルコキシ基、ハロC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルコキシ基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルチオ基、ハロC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルチオ基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルスルフィニル基、ハロC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルスルフィニル基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルスルホニル基、ハロC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルスルホニル基、モノC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルアミノ基又は同一若しくは異なっても良いジC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルアミノ基から選択される1以上の置換基を有する置換C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>アルケニレン基、C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>アルキニレン基又は同一若しくは異なっても良く、ハロゲン原子、シアノ基、ニトロ基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルコキシ基、ハロC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルコキシ基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルチオ基、ハロC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルチオ基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルスルフィニル基、ハロC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルスルフィニル基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルスルホニル基、ハロC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルスルホニル基、モノC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルアミノ基又は同一若しくは異なっても良いジC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルアミノ基から選択される1以上の置換基を有する置換C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>アルキニレン基を示す。又、
- 20 C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキレン基、置換C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキレン基、C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>アルケニレン基、置換C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>アルケニレン基、C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>アルキニレン基又は置換C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>アルキニレン基中の任意の
- 25 飽和炭素原子はC<sub>2</sub>-C<sub>5</sub>アルキレン基で置換されてC<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>シクロアルカン環を示すこ

ともでき、 $C_2-C_6$ アルキレン基、置換 $C_2-C_6$ アルキレン基、 $C_3-C_6$ アルケニレン基又は置換 $C_3-C_6$ アルケニレン基中の任意の2個の炭素原子はアルキレン基又はアルケニレン基と一緒にあって $C_3-C_6$ シクロアルカン環又は $C_3-C_6$ シクロアルケン環を示すこともできる。

- 5  $R^1$ は水素原子、 $C_1-C_6$ アルキル基、同一又は異なっても良く、ハロゲン原子、シアノ基、ニトロ基、水酸基、 $C_1-C_6$ アルコキシ基、ハロ $C_1-C_6$ アルコキシ基、 $C_1-C_6$ アルキルチオ基、ハロ $C_1-C_6$ アルキルチオ基、 $C_1-C_6$ アルキルスルフィニル基、ハロ $C_1-C_6$ アルキルスルフィニル基、 $C_1-C_6$ アルキルスルホニル基、ハロ $C_1-C_6$ アルキルスルホニル基、モノ $C_1-C_6$ アルキルアミノ基、モノ（ハロ $C_1-C_6$ アルキル）ア
- 10 ミノ基、同一又は異なっても良いジ $C_1-C_6$ アルキルアミノ基、同一又は異なっても良いジ（ハロ $C_1-C_6$ アルキル）アミノ基、 $C_1-C_6$ アルコキシカルボニル基、 $C_1-C_6$ アルキルアミノカルボニル基、 $(C_1-C_6)$ アルキルカルボニルオキシ基、フェノキシ基、同一又は異なっても良く、ハロゲン原子、 $(C_1-C_6)$ アルキル基、ハロ $(C_1-C_6)$ アルキル基、 $(C_1-C_6)$ アルコキシ基、ハロ $(C_1-C_6)$ アルコキシ基、
- 15  $(C_1-C_6)$ アルキルチオ基、ハロ $(C_1-C_6)$ アルキルチオ基、 $(C_1-C_6)$ アルキルスルフィニル基、ハロ $(C_1-C_6)$ アルキルスルフィニル基、 $(C_1-C_6)$ アルキルスルホニル基、ハロ $(C_1-C_6)$ アルキルスルホニル基又は $(C_1-C_6)$ アルコキシカルボニル基から選択される1以上の置換基を有するフェノキシ基、フェニルチオ基、同一又は異なっても良く、ハロゲン原子、 $(C_1-C_6)$ アルキル基、ハロ $(C_1-C_6)$
- 20 アルキル基、 $(C_1-C_6)$ アルコキシ基、ハロ $(C_1-C_6)$ アルコキシ基、 $(C_1-C_6)$ アルキルチオ基、ハロ $(C_1-C_6)$ アルキルチオ基、 $(C_1-C_6)$ アルキルスルフィニル基、ハロ $(C_1-C_6)$ アルキルスルフィニル基、 $(C_1-C_6)$ アルキルスルホニル基、ハロ $(C_1-C_6)$ アルキルスルホニル基又は $(C_1-C_6)$ アルコキシカルボニル基から選択される1以上の置換基を有するフェニルチオ基、フェニル基、同一又は異な
- 25 っても良く、ハロゲン原子、シアノ基、ニトロ基、 $C_1-C_6$ アルキル基、ハロ $C_1-C_6$ アルキル基、 $C_1-C_6$ アルコキシ基、ハロ $C_1-C_6$ アルコキシ基、モノ $C_1-C_6$ アルキルアミノ基、同一又は異なっても良いジ $C_1-C_6$ アルキルアミノ基、 $C_1-C_6$ アルキルチオ基、ハロ $C_1-C_6$ アルキルチオ基、 $C_1-C_6$ アルキルスルフィニル基、ハロ $C_1-C_6$ アルキルスルフィニル基、 $C_1-C_6$ アルキルスルホニル基、ハロ $C_1-C_6$ アルキルスルホニル

- 基又はC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルコキシカルボニル基から選択される1以上の置換基を有する置換フェニル基、ピリジル基又は同一若しくは異なっても良く、ハロゲン原子、シアノ基、ニトロ基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキル基、ハロC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキル基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルコキシ基、ハロC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルコキシ基、モノC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルアミノ基、同一又は異なっても良い
- 5 ジC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルアミノ基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルチオ基、ハロC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルチオ基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルスルフィニル基、ハロC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルスルフィニル基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルスルホニル基、ハロC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルスルホニル基又はC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルコキシカルボニル基から選択される1以上の置換基を有する置換ピリジル基から選択される1以上の置換基を有する置換C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキル基、C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>アルケニル基、ハロC<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>アルケ
- 10 ニル基、C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>アルキニル基、ハロC<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>アルキニル基、C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>シクロアルキル基、水酸基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルコキシ基、ハロC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルコキシ基、アミノ基、モノC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルアミノ基、モノ（ハロC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキル）アミノ基、同一又は異なっても良いジC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルアミノ基、同一又は異なっても良いジ（ハロC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキル）アミノ基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルカルボニルアミノ基、フェニルアミノ基、同一又は異な
- 15 っても良く、ハロゲン原子、シアノ基、ニトロ基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキル基、ハロC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキル基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルコキシ基、ハロC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルコキシ基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルチオ基、ハロC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルチオ基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルスルフィニル基、ハロC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルスルフィニル基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルスルホニル基、ハロC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルスルホニル基、モノC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルアミノ基、モノ（ハロC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキル）アミノ基、同一又は異
- 20 なっても良いジC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルアミノ基、同一又は異なっても良いジ（ハロC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキル）アミノ基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルコキシカルボニル基又はC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルアミノカルボニル基から選択される1以上の置換基を環上に有する置換フェニルアミノ基、ベンゾイルアミノ基、同一又は異なっても良く、ハロゲン原子、シアノ基、ニトロ基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキル基、ハロC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキル基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルコキシ基、ハロC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>
- 25 アルコキシ基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルチオ基、ハロC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルチオ基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルスルフィニル基、ハロC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルスルフィニル基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルスルホニル基、ハロC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルスルホニル基、モノC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルアミノ基、モノ（ハロC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキル）アミノ基、同一又は異なっても良いジC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルアミノ基、同一又は異なっても良いジ（ハロC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキル）アミノ基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルコキシカ



ルボニル基又は $C_1-C_6$ アルキルアミノカルボニル基から選択される1以上の置換  
 基を環上に有する置換ベンゾイルアミノ基、 $-N=C(T^1)T^2$  (式中、 $T^1$ 及  
 び $T^2$ は同一又は異なっても良く、水素原子、 $C_1-C_6$ アルキル基、ハロ $C_1-C_6$ アルキ  
 ル基、フェニル基又は同一若しくは異なっても良く、ハロゲン原子、シアノ基、  
 5 ニトロ基、 $C_1-C_6$ アルキル基、ハロ $C_1-C_6$ アルキル基、 $C_1-C_6$ アルコキシ基、ハロ  
 $C_1-C_6$ アルコキシ基、 $C_1-C_6$ アルキルチオ基、ハロ $C_1-C_6$ アルキルチオ基、 $C_1-C_6$ ア  
 ルキルスルフィニル基、ハロ $C_1-C_6$ アルキルスルフィニル基、 $C_1-C_6$ アルキルスル  
 ホニル基、ハロ $C_1-C_6$ アルキルスルホニル基、モノ $C_1-C_6$ アルキルアミノ基、モノ  
 (ハロ $C_1-C_6$ アルキル) アミノ基、同一又は異なっても良い $C_1-C_6$ アルキルアミ  
 10 ノ基、同一又は異なっても良いジ(ハロ $C_1-C_6$ アルキル) アミノ基、 $C_1-C_6$ アルコ  
 キシカルボニル基又は $C_1-C_6$ アルキルアミノカルボニル基から選択される1以上  
 の置換基を有する置換フェニル基を示す。) 、フェニル基、同一又は異なっても  
 良く、ハロゲン原子、シアノ基、ニトロ基、 $C_1-C_6$ アルキル基、ハロ $C_1-C_6$ アルキ  
 ル基、 $C_1-C_6$ アルコキシ基、ハロ $C_1-C_6$ アルコキシ基、 $C_1-C_6$ アルキルチオ基、ハロ  
 15  $C_1-C_6$ アルキルチオ基、 $C_1-C_6$ アルキルスルフィニル基、ハロ $C_1-C_6$ アルキルスルフ  
 イニル基、 $C_1-C_6$ アルキルスルホニル基、ハロ $C_1-C_6$ アルキルスルホニル基、モノ  
 $C_1-C_6$ アルキルアミノ基、モノ(ハロ $C_1-C_6$ アルキル) アミノ基、同一又は異なっ  
 ても良い $C_1-C_6$ アルキルアミノ基、同一又は異なっても良いジ(ハロ $C_1-C_6$ アル  
 キル) アミノ基、 $C_1-C_6$ アルコキシカルボニル基又は $C_1-C_6$ アルキルアミノカルボ  
 20 ニル基から選択される1以上の置換基を有する置換フェニル基、ピリジル基又は  
 同一若しくは異なっても良く、ハロゲン原子、シアノ基、ニトロ基、 $C_1-C_6$ アル  
 キル基、ハロ $C_1-C_6$ アルキル基、 $C_1-C_6$ アルコキシ基、ハロ $C_1-C_6$ アルコキシ基、  
 $C_1-C_6$ アルキルチオ基、ハロ $C_1-C_6$ アルキルチオ基、 $C_1-C_6$ アルキルスルフィニル基、  
 ハロ $C_1-C_6$ アルキルスルフィニル基、 $C_1-C_6$ アルキルスルホニル基、ハロ $C_1-C_6$ アル  
 25 キルスルホニル基、モノ $C_1-C_6$ アルキルアミノ基、モノ(ハロ $C_1-C_6$ アルキル) ア  
 ミノ基、同一又は異なっても良い $C_1-C_6$ アルキルアミノ基、同一又は異なっ  
 ても良いジ(ハロ $C_1-C_6$ アルキル) アミノ基又は $C_1-C_6$ アルコキシカルボニル基から  
 選択される1以上の置換基を有する置換ピリジル基を示す。

$R^2$ 、 $R^3$ 及び $R^4$ は同一又は異なっても良く、水素原子、 $C_1-C_6$ アルキル基、 $C_3-$

C<sub>6</sub>アルケニル基、C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>アルキニル基、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>アルコキシC<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>アルキル基又はC<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>アルキルチオC<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>アルキル基を示す。又、R<sup>2</sup>はA又はR<sup>1</sup>と結合して、1～3個の同一又は異なっても良い酸素原子、硫黄原子又は窒素原子により中断されても良い3～8員環を形成することができ、該3～8員環は同一又は異なっても良く、ハロゲン原子、(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)アルキル基、(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)アルコキシ基から選択される1以上の置換基を有することもできる。又、R<sup>2</sup>はR<sup>1</sup>と一緒に=C(T<sup>3</sup>)T<sup>4</sup>(式中、T<sup>3</sup>及びT<sup>4</sup>は同一又は異なっても良く、水素原子、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキル基、ハロC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキル基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルコキシ基、ハロC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルコキシ基、アミノ基、モノC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルアミノ基、同一又は異なっても良いジC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルアミノ基、モノ(ハロC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキル)アミノ基、同一又は異なっても良いジ(ハロC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキル)アミノ基、フェニル基又は同一若しくは異なっても良く、ハロゲン原子、シアノ基、ニトロ基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキル基、ハロC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキル基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルコキシ基、ハロC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルコキシ基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルチオ基、ハロC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルチオ基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルスルフィニル基、ハロC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルスルフィニル基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルスルホニル基、ハロC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルスルホニル基、モノC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルアミノ基、モノ(ハロC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキル)アミノ基、同一又は異なっても良いジC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルアミノ基、同一又は異なっても良いジ(ハロC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキル)アミノ基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルコキシカルボニル基又はC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルアミノカルボニル基から選択される1以上の置換基を有する置換フェニル基を示す。)を示すことができる。

Qは炭素原子又は窒素原子を示す。

Xは同一又は異なっても良く、ハロゲン原子、シアノ基、ニトロ基、アミノ基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキル基、ハロC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキル基、C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>アルケニル基、ハロC<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>アルケニル基、C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>アルキニル基、ハロC<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>アルキニル基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルコキシ基、ハロC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルコキシ基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルカルボニルオキシ基、ハロC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルカルボニルオキシ基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルチオ基、ハロC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルチオ基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルスルフィニル基、ハロC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルスルフィニル基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルスルホニル基、ハロC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルスルホニル基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルスルホニルオキシ基、ハロC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルスルホニルオキシ基、モノC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルアミノ基、モノ(ハロC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキル)アミノ基、同一又は異なっても良いジC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルアミノ基、同一又は異なっても良いジ(ハロC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキル)アミノ基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルコキシカルボニル基又はC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルアミノカルボニル基から選択される1以上の置換基を有する置換フェニル基を示す。)を示すことができる。

C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキル) アミノ基、同一又は異なっても良いジC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルアミノ基、同一又は異なっても良いジ (ハロC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキル) アミノ基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルカルボニルアミノ基、ハロC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルカルボニルアミノ基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルスルホニルアミノ基又はハロC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルスルホニルアミノ基を示す。

- 5 又、芳香環上の隣接した2個のXは一緒になって縮合環を形成することができ、該縮合環は同一又は異なっても良く、ハロゲン原子、ニトロ基、シアノ基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキル基、ハロC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキル基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルコキシ基、ハロC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルコキシ基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルチオ基、ハロC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルチオ基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルスルフィニル基、ハロC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルスルフィニル基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルスルホニル基、ハロC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルスルホニル基、モノC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルアミノ基、モノ (ハロC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキル) アミノ基、同一又は異なっても良いジC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルアミノ基又は同一若しくは異なっても良いジ (ハロC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキル) アミノ基から選択される1以上の置換基を有することもできる。mは0~2の整数を示す。

- Yは同一又は異なっても良く、ハロゲン原子、シアノ基、ニトロ基、水酸基、
- 15 ホルミル基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキル基、ヒドロキシC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキル基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルコキシC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキル基、ハロC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルコキシC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキル基、ハロC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキル基、ヒドロキシハロC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキル基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルコキシハロC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキル基、ハロC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルコキシハロC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキル基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルコキシ基、ハロC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルコキシ基、ハロC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルコキシハロC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルコキシ基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルチオ基、ハロC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルチオ基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルスルフィニル基、ハロC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルスルフィニル基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルスルホニル基、ハロC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルスルホニル基、ハロC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルコキシハロC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルチオ基、ハロC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルコキシハロC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルスルフィニル基、ハロC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルコキシハロC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルスルホニル基、フェノキシ基、同一又は異なっても良く、ハロゲン原子、シアノ基、ニトロ基、
- 20 C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキル基、ハロC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキル基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルコキシ基、ハロC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルコキシ基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルチオ基、ハロC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルチオ基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルスルフィニル基、ハロC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルスルフィニル基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルスルホニル基又はハロC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルスルホニル基から選択される1以上の置換基を有する置換フェノキシ基、フェニルチオ基、同一又は異なっても良く、ハロゲン原子、シアノ

- 基、ニトロ基、 $C_1-C_6$ アルキル基、ハロ $C_1-C_6$ アルキル基、 $C_1-C_6$ アルコキシ基、ハロ $C_1-C_6$ アルコキシ基、 $C_1-C_6$ アルキルチオ基、ハロ $C_1-C_6$ アルキルチオ基、 $C_1-C_6$ アルキルスルフィニル基、ハロ $C_1-C_6$ アルキルスルフィニル基、 $C_1-C_6$ アルキルスルホニル基又はハロ $C_1-C_6$ アルキルスルホニル基から選択される1以上の置換基
- 5 有する置換フェニルチオ基、ピリジルオキシ基又は同一若しくは異なっても良く、ハロゲン原子、シアノ基、ニトロ基、 $C_1-C_6$ アルキル基、ハロ $C_1-C_6$ アルキル基、 $C_1-C_6$ アルコキシ基、ハロ $C_1-C_6$ アルコキシ基、 $C_1-C_6$ アルキルチオ基、ハロ $C_1-C_6$ アルキルチオ基、 $C_1-C_6$ アルキルスルフィニル基、ハロ $C_1-C_6$ アルキルスルフィニル基、 $C_1-C_6$ アルキルスルホニル基又はハロ $C_1-C_6$ アルキルスルホニル基から
- 10 選択される1以上の置換基を有する置換ピリジルオキシ基を示す。

- 又、芳香環上の隣接した2個のYは一緒になって縮合環を形成することができ、該縮合環は同一又は異なっても良く、ハロゲン原子、ニトロ基、シアノ基、 $C_1-C_6$ アルキル基、ハロ $C_1-C_6$ アルキル基、 $C_1-C_6$ アルコキシ基、ハロ $C_1-C_6$ アルコキシ基、 $C_1-C_6$ アルキルチオ基、ハロ $C_1-C_6$ アルキルチオ基、 $C_1-C_6$ アルキルスルフィニル基、ハロ $C_1-C_6$ アルキルスルフィニル基、 $C_1-C_6$ アルキルスルホニル基、ハロ $C_1-C_6$ アルキルスルホニル基、モノ $C_1-C_6$ アルキルアミノ基、モノ（ハロ $C_1-C_6$ アルキル）アミノ基、同一又は異なっても良いジ $C_1-C_6$ アルキルアミノ基又は同一若しくは異なっても良いジ（ハロ $C_1-C_6$ アルキル）アミノ基から選択される1以上の置換基を有することもできる。nは0～3の整数を示す。}
- 15
- 20 で表されるスルホンアミド誘導体又はその塩類。

2. Aが $C_1-C_6$ アルキレン基、同一又は異なっても良く、ハロゲン原子、 $C_1-C_6$ アルコキシ基、ハロ $C_1-C_6$ アルコキシ基、 $C_1-C_6$ アルキルチオ基、ハロ $C_1-C_6$ アルキルチオ基、 $C_1-C_6$ アルキルスルフィニル基、ハロ $C_1-C_6$ アルキルスルフィニル基、 $C_1-C_6$ アルキルスルホニル基又はハロ $C_1-C_6$ アルキルスルホニル基から選択される
- 25 1以上の置換基を有する置換 $C_1-C_6$ アルキレン基、 $C_3-C_6$ アルケニレン基、同一又は異なっても良く、ハロゲン原子、 $C_1-C_6$ アルコキシ基、ハロ $C_1-C_6$ アルコキシ基、 $C_1-C_6$ アルキルチオ基、ハロ $C_1-C_6$ アルキルチオ基、 $C_1-C_6$ アルキルスルフィニル基、ハロ $C_1-C_6$ アルキルスルフィニル基、 $C_1-C_6$ アルキルスルホニル基又はハロ $C_1-C_6$ アルキルスルホニル基から選択される1以上の置換基を有する置換 $C_3-C_6$ アルケニ

- レン基、 $C_3-C_6$ アルキニレン基又は同一若しくは異なっても良く、ハロゲン原子、 $C_1-C_6$ アルコキシ基、ハロ $C_1-C_6$ アルコキシ基、 $C_1-C_6$ アルキルチオ基、ハロ $C_1-C_6$ アルキルチオ基、 $C_1-C_6$ アルキルスルフィニル基、ハロ $C_1-C_6$ アルキルスルフィニル基、 $C_1-C_6$ アルキルスルホニル基又はハロ $C_1-C_6$ アルキルスルホニル基から選択
- 5 される1以上の置換基を有する置換 $C_3-C_6$ アルキニレン基を示し、 $C_1-C_6$ アルキレン基、置換 $C_1-C_6$ アルキレン基、 $C_3-C_6$ アルケニレン基、置換 $C_3-C_6$ アルケニレン基、 $C_3-C_6$ アルキニレン基又は置換 $C_3-C_6$ アルキニレン基中の任意の飽和炭素原子は $C_2-C_5$ アルキレン基で置換されて $C_3-C_6$ シクロアルカン環を示すこともでき、 $C_2-C_6$ アルキレン基、置換 $C_2-C_6$ アルキレン基、 $C_3-C_6$ アルケニレン基又は置換 $C_3-C_6$ アルケニレン基中の任意の2個の炭素原子はアルキレン基又はアルケニレン基と一緒に
- 10 なって $C_3-C_6$ シクロアルカン環又は $C_3-C_6$ シクロアルケン環を示すこともでき、  
 $R^1$ が水素原子、 $C_1-C_6$ アルキル基、同一又は異なっても良く、ハロゲン原子、シアノ基、ニトロ基、水酸基、 $C_1-C_6$ アルコキシ基、ハロ $C_1-C_6$ アルコキシ基、 $C_1-C_6$ アルキルチオ基、ハロ $C_1-C_6$ アルキルチオ基、 $C_1-C_6$ アルキルスルフィニル基、ハロ $C_1-C_6$ アルキルスルフィニル基、 $C_1-C_6$ アルキルスルホニル基、ハロ $C_1-C_6$ アルキルスルホニル基、モノ $C_1-C_6$ アルキルアミノ基、モノ（ハロ $C_1-C_6$ アルキル）アミノ基、同一又は異なっても良いジ $C_1-C_6$ アルキルアミノ基、同一又は異なっても良いジ（ハロ $C_1-C_6$ アルキル）アミノ基、 $C_1-C_6$ アルコキシカルボニル基、 $C_1-C_6$ アルキルアミノカルボニル基、 $(C_1-C_6)$ アルキルカルボニルオキシ基、フェノ
- 15 キシ基、同一又は異なっても良く、ハロゲン原子、 $(C_1-C_6)$ アルキル基、ハロ $(C_1-C_6)$ アルキル基、 $(C_1-C_6)$ アルコキシ基、ハロ $(C_1-C_6)$ アルコキシ基、 $(C_1-C_6)$ アルキルチオ基、ハロ $(C_1-C_6)$ アルキルチオ基、 $(C_1-C_6)$ アルキルスルフィニル基、ハロ $(C_1-C_6)$ アルキルスルフィニル基、 $(C_1-C_6)$ アルキルスルホニル基、ハロ $(C_1-C_6)$ アルキルスルホニル基又は $(C_1-C_6)$ アルコキシカルボ
- 20 ニル基から選択される1以上の置換基を有するフェノキシ基、フェニルチオ基、同一又は異なっても良く、ハロゲン原子、 $(C_1-C_6)$ アルキル基、ハロ $(C_1-C_6)$ アルキル基、 $(C_1-C_6)$ アルコキシ基、ハロ $(C_1-C_6)$ アルコキシ基、 $(C_1-C_6)$ アルキルチオ基、ハロ $(C_1-C_6)$ アルキルチオ基、 $(C_1-C_6)$ アルキルスルフィニル基、ハロ $(C_1-C_6)$ アルキルスルフィニル基、 $(C_1-C_6)$ アルキルスルホニル基、
- 25



- ハロ (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>) アルキルスルホニル基又は (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>) アルコキシカルボニル基から  
選択される 1 以上の置換基を有するフェニルチオ基、フェニル基、同一又は異な  
っても良く、ハロゲン原子、シアノ基、ニトロ基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキル基、ハロC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>  
アルキル基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルコキシ基、ハロC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルコキシ基、モノC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルア  
5 ミノ基、同一又は異なっても良いジC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルアミノ基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルチオ  
基、ハロC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルチオ基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルスルフィニル基、ハロC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキ  
ルスルフィニル基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルスルホニル基、ハロC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルスルホニル  
基又はC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルコキシカルボニル基から選択される 1 以上の置換基を有する置  
換フェニル基、ピリジル基又は同一若しくは異なっても良く、ハロゲン原子、シ  
10 アノ基、ニトロ基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキル基、ハロC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキル基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルコキシ基、  
ハロC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルコキシ基、モノC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルアミノ基、同一又は異なっても良い  
ジC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルアミノ基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルチオ基、ハロC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルチオ基、  
C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルスルフィニル基、ハロC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルスルフィニル基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキ  
ルスルホニル基、ハロC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルスルホニル基又はC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルコキシカルボニ  
15 ル基から選択される 1 以上の置換基を有する置換ピリジル基から選択される 1 以  
上の置換基を有する置換C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキル基、C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>アルケニル基、ハロC<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>アルケ  
ニル基、C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>アルキニル基、ハロC<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>アルキニル基、C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>シクロアルキル基、  
水酸基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルコキシ基、ハロC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルコキシ基、アミノ基、モノC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アル  
キルアミノ基、モノ (ハロC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキル) アミノ基、同一又は異なっても良い  
20 ジC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルアミノ基、同一又は異なっても良いジ (ハロC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキル) ア  
ミノ基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルカルボニルアミノ基、フェニルアミノ基、同一又は異な  
っても良く、ハロゲン原子、シアノ基、ニトロ基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキル基、ハロC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>  
アルキル基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルコキシ基、ハロC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルコキシ基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルチオ基、  
ハロC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルチオ基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルスルフィニル基、ハロC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルス  
25 ルフィニル基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルスルホニル基、ハロC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルスルホニル基、  
モノC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルアミノ基、モノ (ハロC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキル) アミノ基、同一又は異  
なっても良いジC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルアミノ基、同一又は異なっても良いジ (ハロC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>  
アルキル) アミノ基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルコキシカルボニル基又はC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルアミノカ  
ルボニル基から選択される 1 以上の置換基を環上に有する置換フェニルアミノ基、

ベンゾイルアミノ基、同一又は異なっても良く、ハロゲン原子、シアノ基、ニトロ基、 $C_1-C_6$ アルキル基、ハロ $C_1-C_6$ アルキル基、 $C_1-C_6$ アルコキシ基、ハロ $C_1-C_6$ アルコキシ基、 $C_1-C_6$ アルキルチオ基、ハロ $C_1-C_6$ アルキルチオ基、 $C_1-C_6$ アルキルスルフィニル基、ハロ $C_1-C_6$ アルキルスルフィニル基、 $C_1-C_6$ アルキルスルホニル基、ハロ $C_1-C_6$ アルキルスルホニル基、モノ $C_1-C_6$ アルキルアミノ基、モノ（ハロ $C_1-C_6$ アルキル）アミノ基、同一又は異なっても良いジ $C_1-C_6$ アルキルアミノ基、同一又は異なっても良いジ（ハロ $C_1-C_6$ アルキル）アミノ基、 $C_1-C_6$ アルコキシカルボニル基又は $C_1-C_6$ アルキルアミノカルボニル基から選択される1以上の置換基を環上に有する置換ベンゾイルアミノ基、フェニル基、同一又は異なっても良く、ハロゲン原子、シアノ基、ニトロ基、 $C_1-C_6$ アルキル基、ハロ $C_1-C_6$ アルキル基、 $C_1-C_6$ アルコキシ基、ハロ $C_1-C_6$ アルコキシ基、 $C_1-C_6$ アルキルチオ基、ハロ $C_1-C_6$ アルキルチオ基、 $C_1-C_6$ アルキルスルフィニル基、ハロ $C_1-C_6$ アルキルスルフィニル基、 $C_1-C_6$ アルキルスルホニル基、ハロ $C_1-C_6$ アルキルスルホニル基、モノ $C_1-C_6$ アルキルアミノ基、モノ（ハロ $C_1-C_6$ アルキル）アミノ基、同一又は異なっても良いジ $C_1-C_6$ アルキルアミノ基、同一又は異なっても良いジ（ハロ $C_1-C_6$ アルキル）アミノ基、 $C_1-C_6$ アルコキシカルボニル基又は $C_1-C_6$ アルキルアミノカルボニル基から選択される1以上の置換基を有する置換フェニル基、ピリジル基又は同一若しくは異なっても良く、ハロゲン原子、シアノ基、ニトロ基、 $C_1-C_6$ アルキル基、ハロ $C_1-C_6$ アルキル基、 $C_1-C_6$ アルコキシ基、ハロ $C_1-C_6$ アルコキシ基、 $C_1-C_6$ アルキルチオ基、ハロ $C_1-C_6$ アルキルチオ基、 $C_1-C_6$ アルキルスルフィニル基、ハロ $C_1-C_6$ アルキルスルフィニル基、 $C_1-C_6$ アルキルスルホニル基、ハロ $C_1-C_6$ アルキルスルホニル基、モノ $C_1-C_6$ アルキルアミノ基、モノ（ハロ $C_1-C_6$ アルキル）アミノ基、同一又は異なっても良いジ $C_1-C_6$ アルキルアミノ基、同一又は異なっても良いジ（ハロ $C_1-C_6$ アルキル）アミノ基又は $C_1-C_6$ アルコキシカルボニル基から選択される1以上の置換基を有する置換ピリジル基を示し、

$R^2$ 、 $R^3$ 及び $R^4$ が同一又は異なっても良く、水素原子、 $C_1-C_6$ アルキル基、 $C_3-C_6$ アルケニル基、 $C_3-C_6$ アルキニル基、 $C_1-C_4$ アルコキシ $C_1-C_4$ アルキル基又は $C_1-C_4$ アルキルチオ $C_1-C_4$ アルキル基を示し、又、 $R^2$ はA又は $R^1$ と結合して、1～3個の同一又は異なっても良い酸素原子、硫黄原子又は窒素原子により中断されて

も良い3～8員環を形成することができ、該3～8員環は同一又は異なっても良く、ハロゲン原子、 $(C_1-C_6)$ アルキル基、 $(C_1-C_6)$ アルコキシ基から選択される1以上の置換基を有することもできる。

Qが炭素原子又は窒素原子を示し、

- 5 Xが同一又は異なっても良く、ハロゲン原子、シアノ基、ニトロ基、 $C_1-C_6$ アルキル基、ハロ $C_1-C_6$ アルキル基、 $C_2-C_6$ アルケニル基、ハロ $C_2-C_6$ アルケニル基、 $C_2-C_6$ アルキニル基、ハロ $C_3-C_6$ アルキニル基、 $C_1-C_6$ アルコキシ基、ハロ $C_1-C_6$ アルコキシ基、 $C_1-C_6$ アルキルカルボニルオキシ基、ハロ $C_1-C_6$ アルキルカルボニルオキシ基、 $C_1-C_6$ アルキルチオ基、ハロ $C_1-C_6$ アルキルチオ基、 $C_1-C_6$ アルキルスル
- 10 フィニル基、ハロ $C_1-C_6$ アルキルスルフィニル基、 $C_1-C_6$ アルキルスルホニル基、ハロ $C_1-C_6$ アルキルスルホニル基、 $C_1-C_6$ アルキルスルホニルオキシ基又はハロ $C_1-C_6$ アルキルスルホニルオキシ基を示し、又、芳香環上の隣接した2個のXは一緒になって縮合環を形成することができ、該縮合環は同一又は異なっても良く、ハロゲン原子、ニトロ基、シアノ基、 $C_1-C_6$ アルキル基、ハロ $C_1-C_6$ アルキル基、 $C_1-C_6$ アルコキシ基、ハロ $C_1-C_6$ アルコキシ基、 $C_1-C_6$ アルキルチオ基、ハロ $C_1-C_6$ アルキルチオ基、 $C_1-C_6$ アルキルスルフィニル基、ハロ $C_1-C_6$ アルキルスルフィニル基、 $C_1-C_6$ アルキルスルホニル基又はハロ $C_1-C_6$ アルキルスルホニル基から選択される
- 15 1以上の置換基を有することもでき、mが0～2の整数を示し、

- Yが同一又は異なっても良く、ハロゲン原子、シアノ基、ニトロ基、水酸基、
- 20 ホルミル基、 $C_1-C_6$ アルキル基、ヒドロキシ $C_1-C_6$ アルキル基、 $C_1-C_6$ アルコキシ $C_1-C_6$ アルキル基、ハロ $C_1-C_6$ アルコキシ $C_1-C_6$ アルキル基、ハロ $C_1-C_6$ アルキル基、ヒドロキシハロ $C_1-C_6$ アルキル基、 $C_1-C_6$ アルコキシハロ $C_1-C_6$ アルキル基、ハロ $C_1-C_6$ アルコキシハロ $C_1-C_6$ アルキル基、 $C_1-C_6$ アルコキシ基、ハロ $C_1-C_6$ アルコキシ基、ハロ $C_1-C_6$ アルコキシハロ $C_1-C_6$ アルコキシ基、 $C_1-C_6$ アルキルチオ基、ハロ
- 25  $C_1-C_6$ アルキルチオ基、 $C_1-C_6$ アルキルスルフィニル基、ハロ $C_1-C_6$ アルキルスルフィニル基、 $C_1-C_6$ アルキルスルホニル基、ハロ $C_1-C_6$ アルキルスルホニル基、ハロ $C_1-C_6$ アルコキシハロ $C_1-C_6$ アルキルチオ基、ハロ $C_1-C_6$ アルコキシハロ $C_1-C_6$ アルキルスルフィニル基、ハロ $C_1-C_6$ アルコキシハロ $C_1-C_6$ アルキルスルホニル基、フェノキシ基、同一又は異なっても良く、ハロゲン原子、シアノ基、ニトロ基、

- C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキル基、ハロC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキル基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルコキシ基、ハロC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルコキシ基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルチオ基、ハロC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルチオ基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルスルフィニル基、ハロC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルスルフィニル基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルスルホニル基又はハロC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルスルホニル基から選択される1以上の置換基を有する置換フェノキシ基、フェニルチオ基、同一又は異なっても良く、ハロゲン原子、シアノ基、ニトロ基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキル基、ハロC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキル基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルコキシ基、ハロC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルコキシ基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルチオ基、ハロC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルチオ基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルスルフィニル基、ハロC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルスルフィニル基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルスルホニル基又はハロC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルスルホニル基から選択される1以上の置換基を有する置換フェニルチオ基、ピリジルオキシ基又は同一若しくは異なっても良く、ハロゲン原子、シアノ基、ニトロ基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキル基、ハロC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキル基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルコキシ基、ハロC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルコキシ基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルチオ基、ハロC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルチオ基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルスルフィニル基、ハロC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルスルフィニル基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルスルホニル基又はハロC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルスルホニル基から選択される1以上の置換基を有する置換ピリジルオキシ基を示し、又、芳香環上の隣接した2個のYは一緒になって縮合環を形成することができ、該縮合環は同一又は異なっても良く、ハロゲン原子、ニトロ基、シアノ基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキル基、ハロC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキル基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルコキシ基、ハロC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルコキシ基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルチオ基、ハロC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルチオ基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルスルフィニル基、ハロC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルスルフィニル基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルスルホニル基、ハロC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルスルホニル基、モノC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルアミノ基、モノ（ハロC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキル）アミノ基、同一又は異なっても良いジC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルアミノ基又は同一若しくは異なっても良いジ（ハロC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキル）アミノ基から選択される1以上の置換基を有することもでき、nが0～3の整数を示す請求項1記載のスルホンアミド誘導体又はその塩類。

3. AがC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキレン基又は同一若しくは異なっても良く、ハロゲン原子、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルコキシ基、ハロC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルコキシ基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルチオ基、ハロC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルチオ基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルスルフィニル基、ハロC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルスルフィニル基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルスルホニル基又はハロC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルスルホニル基から選択

される 1 以上の置換基を有する置換 $C_1-C_6$ アルキレン基を示し、又、 $C_1-C_6$ アルキレン基又は置換 $C_1-C_6$ アルキレン基中の任意の炭素原子は $C_2-C_5$ アルキレン基で置換されて $C_3-C_6$ シクロアルカン環を示すこともでき、 $C_2-C_6$ アルキレン基又は置換 $C_2-C_6$ アルキレン基中の任意の 2 個の炭素原子はアルキレン基と一緒になって $C_3-C_6$ シクロアルカン環を示すこともでき、

- $R^1$ が水素原子、 $C_1-C_6$ アルキル基、同一又は異なっても良く、ハロゲン原子、シアノ基、ニトロ基、水酸基、 $C_1-C_6$ アルコキシ基、ハロ $C_1-C_6$ アルコキシ基、 $C_1-C_6$ アルキルチオ基、ハロ $C_1-C_6$ アルキルチオ基、 $C_1-C_6$ アルキルスルフィニル基、ハロ $C_1-C_6$ アルキルスルフィニル基、 $C_1-C_6$ アルキルスルホニル基、ハロ $C_1-C_6$ アルキルスルホニル基、モノ $C_1-C_6$ アルキルアミノ基、モノ（ハロ $C_1-C_6$ アルキル）アミノ基、同一又は異なっても良いジ $C_1-C_6$ アルキルアミノ基、同一又は異なっても良いジ（ハロ $C_1-C_6$ アルキル）アミノ基、 $C_1-C_6$ アルコキシカルボニル基、 $C_1-C_6$ アルキルアミノカルボニル基、 $(C_1-C_6)$ アルキルカルボニルオキシ基、フェノキシ基、同一又は異なっても良く、ハロゲン原子、 $(C_1-C_6)$ アルキル基、ハロ $(C_1-C_6)$ アルキル基、 $(C_1-C_6)$ アルコキシ基、ハロ $(C_1-C_6)$ アルコキシ基、 $(C_1-C_6)$ アルキルチオ基、ハロ $(C_1-C_6)$ アルキルチオ基、 $(C_1-C_6)$ アルキルスルフィニル基、ハロ $(C_1-C_6)$ アルキルスルフィニル基、 $(C_1-C_6)$ アルキルスルホニル基、ハロ $(C_1-C_6)$ アルキルスルホニル基又は $(C_1-C_6)$ アルコキシカルボニル基から選択される 1 以上の置換基を有するフェノキシ基、フェニルチオ基、同一又は異なっても良く、ハロゲン原子、 $(C_1-C_6)$ アルキル基、ハロ $(C_1-C_6)$ アルキル基、 $(C_1-C_6)$ アルコキシ基、ハロ $(C_1-C_6)$ アルコキシ基、 $(C_1-C_6)$ アルキルチオ基、ハロ $(C_1-C_6)$ アルキルチオ基、 $(C_1-C_6)$ アルキルスルフィニル基、ハロ $(C_1-C_6)$ アルキルスルフィニル基、 $(C_1-C_6)$ アルキルスルホニル基、ハロ $(C_1-C_6)$ アルキルスルホニル基又は $(C_1-C_6)$ アルコキシカルボニル基から選択される 1 以上の置換基を有するフェニルチオ基、フェニル基、同一又は異なっても良く、ハロゲン原子、シアノ基、ニトロ基、 $C_1-C_6$ アルキル基、ハロ $C_1-C_6$ アルキル基、 $C_1-C_6$ アルコキシ基、ハロ $C_1-C_6$ アルコキシ基、モノ $C_1-C_6$ アルキルアミノ基、同一又は異なっても良いジ $C_1-C_6$ アルキルアミノ基、 $C_1-C_6$ アルキルチオ基、ハロ $C_1-C_6$ アルキルチオ基、 $C_1-C_6$ アルキルスルフィニル基、ハロ $C_1-C_6$ アルキ



- ルスルフィニル基、 $C_1-C_6$ アルキルスルホニル基、ハロ $C_1-C_6$ アルキルスルホニル基又は $C_1-C_6$ アルコキシカルボニル基から選択される1以上の置換基を有する置換フェニル基、ピリジル基又は同一若しくは異なっても良く、ハロゲン原子、シアノ基、ニトロ基、 $C_1-C_6$ アルキル基、ハロ $C_1-C_6$ アルキル基、 $C_1-C_6$ アルコキシ基、
- 5 ハロ $C_1-C_6$ アルコキシ基、モノ $C_1-C_6$ アルキルアミノ基、同一又は異なっても良いジ $C_1-C_6$ アルキルアミノ基、 $C_1-C_6$ アルキルチオ基、ハロ $C_1-C_6$ アルキルチオ基、 $C_1-C_6$ アルキルスルフィニル基、ハロ $C_1-C_6$ アルキルスルフィニル基、 $C_1-C_6$ アルキルスルホニル基、ハロ $C_1-C_6$ アルキルスルホニル基又は $C_1-C_6$ アルコキシカルボニル基から選択される1以上の置換基を有する置換ピリジル基から選択される1以
- 10 上の置換基を有する置換 $C_1-C_6$ アルキル基、 $C_3-C_6$ アルケニル基、ハロ $C_3-C_6$ アルケニル基、 $C_3-C_6$ アルキニル基、ハロ $C_3-C_6$ アルキニル基、 $C_3-C_6$ シクロアルキル基、水酸基、 $C_1-C_6$ アルコキシ基、ハロ $C_1-C_6$ アルコキシ基、アミノ基、モノ $C_1-C_6$ アルキルアミノ基、モノ（ハロ $C_1-C_6$ アルキル）アミノ基、同一又は異なっても良いジ $C_1-C_6$ アルキルアミノ基、同一又は異なっても良いジ（ハロ $C_1-C_6$ アルキル）ア
- 15 ミノ基、 $C_1-C_6$ アルキルカルボニルアミノ基、フェニルアミノ基、同一又は異なっても良く、ハロゲン原子、シアノ基、ニトロ基、 $C_1-C_6$ アルキル基、ハロ $C_1-C_6$ アルキル基、 $C_1-C_6$ アルコキシ基、ハロ $C_1-C_6$ アルコキシ基、 $C_1-C_6$ アルキルチオ基、ハロ $C_1-C_6$ アルキルチオ基、 $C_1-C_6$ アルキルスルフィニル基、ハロ $C_1-C_6$ アルキルスルフィニル基、 $C_1-C_6$ アルキルスルホニル基、ハロ $C_1-C_6$ アルキルスルホニル基、
- 20 モノ $C_1-C_6$ アルキルアミノ基、モノ（ハロ $C_1-C_6$ アルキル）アミノ基、同一又は異なっても良いジ $C_1-C_6$ アルキルアミノ基、同一又は異なっても良いジ（ハロ $C_1-C_6$ アルキル）アミノ基、 $C_1-C_6$ アルコキシカルボニル基又は $C_1-C_6$ アルキルアミノカルボニル基から選択される1以上の置換基を環上に有する置換フェニルアミノ基、ベンゾイルアミノ基、同一又は異なっても良く、ハロゲン原子、シアノ基、ニト
- 25 ロ基、 $C_1-C_6$ アルキル基、ハロ $C_1-C_6$ アルキル基、 $C_1-C_6$ アルコキシ基、ハロ $C_1-C_6$ アルコキシ基、 $C_1-C_6$ アルキルチオ基、ハロ $C_1-C_6$ アルキルチオ基、 $C_1-C_6$ アルキルスルフィニル基、ハロ $C_1-C_6$ アルキルスルフィニル基、 $C_1-C_6$ アルキルスルホニル基、ハロ $C_1-C_6$ アルキルスルホニル基、モノ $C_1-C_6$ アルキルアミノ基、モノ（ハロ $C_1-C_6$ アルキル）アミノ基、同一又は異なっても良いジ $C_1-C_6$ アルキルアミノ基、

- 同一又は異なっても良いジ（ハロC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキル）アミノ基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルコキシカルボニル基又はC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルアミノカルボニル基から選択される1以上の置換基を環上に有する置換ベンゾイルアミノ基、フェニル基、同一又は異なっても良く、ハロゲン原子、シアノ基、ニトロ基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキル基、ハロC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキル
- 5 基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルコキシ基、ハロC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルコキシ基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルチオ基、ハロC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルチオ基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルスルフィニル基、ハロC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルスルフィニル基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルスルホニル基、ハロC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルスルホニル基、モノC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルアミノ基、モノ（ハロC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキル）アミノ基、同一又は異なっても良いジC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルアミノ基、同一又は異なっても良いジ（ハロC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アル
- 10 キル）アミノ基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルコキシカルボニル基又はC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルアミノカルボニル基から選択される1以上の置換基を有する置換フェニル基、ピリジル基又は同一若しくは異なっても良く、ハロゲン原子、シアノ基、ニトロ基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキル基、ハロC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキル基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルコキシ基、ハロC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルコキシ基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルチオ基、ハロC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルチオ基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルスルフィニル基、
- 15 ハロC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルスルフィニル基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルスルホニル基、ハロC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルスルホニル基、モノC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルアミノ基、モノ（ハロC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキル）アミノ基、同一又は異なっても良いジC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルアミノ基、同一又は異なっても良いジ（ハロC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキル）アミノ基又はC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルコキシカルボニル基から選択される1以上の置換基を有する置換ピリジル基を示し、
- 20 R<sup>2</sup>、R<sup>3</sup>及びR<sup>4</sup>が同一又は異なっても良く、水素原子、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキル基、C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>アルケニル基、C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>アルキニル基、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>アルコキシC<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>アルキル基又はC<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>アルキルチオC<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>アルキル基を示し、又、R<sup>2</sup>はA又はR<sup>1</sup>と結合して、1～3個の同一又は異なっても良い酸素原子、硫黄原子又は窒素原子により中断されても良い3～8員環を形成することができ、該3～8員環は同一又は異なっても良
- 25 く、ハロゲン原子、(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)アルキル基、(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)アルコキシ基から選択される1以上の置換基を有することもできる。

Qが炭素原子又は窒素原子を示し、

Xが同一又は異なっても良く、ハロゲン原子、ニトロ基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキル基、ハロC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキル基、C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>アルケニル基、ハロC<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>アルケニル基、C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>アル

キニル基、ハロC<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>アルキニル基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルコキシ基、ハロC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルコキシ基、  
C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルカルボニルオキシ基、ハロC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルカルボニルオキシ基、C<sub>1</sub>-  
C<sub>6</sub>アルキルチオ基、ハロC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルチオ基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルスルフィニル基、  
ハロC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルスルフィニル基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルスルホニル基、ハロC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アル  
5 キルスルホニル基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルスルホニルオキシ基又はハロC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルス  
ルホニルオキシ基を示し、又、芳香環上の隣接した2個のXは一緒になって縮合  
環を形成することができ、該縮合環は同一又は異なっても良く、ハロゲン原子、  
ニトロ基、シアノ基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキル基、ハロC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキル基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルコキシ  
基、ハロC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルコキシ基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルチオ基、ハロC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルチオ基、  
10 C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルスルフィニル基、ハロC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルスルフィニル基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキ  
ルスルホニル基又はハロC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルスルホニル基から選択される1以上の置  
換基を有することもでき、mが0～2の整数を示し、

Yが同一又は異なっても良く、ハロゲン原子、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキル基、ハロC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アル  
コキシC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキル基、ハロC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキル基、ヒドロキシハロC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキル  
15 基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルコキシハロC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキル基、ハロC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルコキシハロC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アル  
キル基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルコキシ基、ハロC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルコキシ基、ハロC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルコキシハロ  
C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルコキシ基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルチオ基、ハロC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルチオ基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アル  
キルスルフィニル基、ハロC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルスルフィニル基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルスル  
ホニル基、ハロC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルスルホニル基、ハロC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルコキシハロC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アル  
20 キルチオ基、ハロC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルコキシハロC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルスルフィニル基、ハロC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>  
アルコキシハロC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルスルホニル基、フェノキシ基、同一又は異なっても  
良く、ハロゲン原子、シアノ基、ニトロ基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキル基、ハロC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アル  
キル基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルコキシ基、ハロC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルコキシ基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルチオ基、ハ  
ロC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルチオ基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルスルフィニル基、ハロC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルスル  
25 フィニル基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルスルホニル基又はハロC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルスルホニル基か  
ら選択される1以上の置換基を有する置換フェノキシ基、フェニルチオ基、同一  
又は異なっても良く、ハロゲン原子、シアノ基、ニトロ基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキル基、  
ハロC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキル基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルコキシ基、ハロC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルコキシ基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アル  
キルチオ基、ハロC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルチオ基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルスルフィニル基、ハロC<sub>1</sub>-

- C<sub>6</sub>アルキルスルフィニル基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルスルホニル基又はハロC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルスルホニル基から選択される1以上の置換基を有する置換フェニルチオ基、ピリジルオキシ基又は同一若しくは異なっても良く、ハロゲン原子、シアノ基、ニトロ基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキル基、ハロC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキル基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルコキシ基、ハロC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルコキシ基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルチオ基、ハロC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルチオ基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルスルフィニル基、ハロC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルスルフィニル基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルスルホニル基又はハロC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルスルホニル基から選択される1以上の置換基を有する置換ピリジルオキシ基を示し、又、芳香環上の隣接した2個のYは一緒になって縮合環を形成することができ、該縮合環は同一又は異なっても良く、ハロゲン原子、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキル基、ハロC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキル基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルコキシ基、ハロC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルコキシ基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルチオ基、ハロC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルチオ基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルスルフィニル基、ハロC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルスルフィニル基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルスルホニル基又はハロC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルスルホニル基から選択される1以上の置換基を有することもでき、nが0～3の整数を示す請求項1記載のスルホンアミド誘導体又はその塩類。
4. 請求項1乃至3記載の一般式(I)で表されるスルホンアミド誘導体又はその塩類を有効成分として含有することを特徴とする農園芸用殺虫剤。
5. 有用植物から害虫を防除するため請求項4記載の農園芸用殺虫剤の有効量を対象作物植物体、土壌又は水田に処理することを特徴とする農園芸用殺虫剤の使用法。

# INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International application No.

PCT/JP03/10774

## A. CLASSIFICATION OF SUBJECT MATTER

Int.Cl<sup>7</sup> C07C311/46, 311/48, 311/49, 311/50, 317/28, 323/49,  
C07D213/75, 213/42, 279/12, A01N41/06, 43/40, 47/02

According to International Patent Classification (IPC) or to both national classification and IPC

## B. FIELDS SEARCHED

Minimum documentation searched (classification system followed by classification symbols)

Int.Cl<sup>7</sup> C07C311/46, 311/48, 311/49, 311/50, 317/28, 323/49,  
C07D213/75, 213/42, 279/12, A01N41/06, 43/40, 47/02

Documentation searched other than minimum documentation to the extent that such documents are included in the fields searched

Electronic data base consulted during the international search (name of data base and, where practicable, search terms used)

REGISTRY (STN), CA (STN)

## C. DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT

Category*	Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages	Relevant to claim No.
P, X	WO 03/11028 A1 (Nissan Chemical Industries, Ltd.), 13 February, 2003 (13.02.03), (Family: none)	1-5
P, X	WO 02/94766 A1 (Nihon Nohyaku Co., Ltd.), 28 November, 2002 (28.11.02), & JP 2003-34672 A	1-5
X	WO 01/46124 A1 (Nihon Nohyaku Co., Ltd.), 28 June, 2001 (28.06.01), & JP 2001-240580 A & EP 1241159 A1	1-5

☐ Further documents are listed in the continuation of Box C. ☐ See patent family annex.

* Special categories of cited documents:	"T" later document published after the international filing date or priority date and not in conflict with the application but cited to understand the principle or theory underlying the invention
"A" document defining the general state of the art which is not considered to be of particular relevance	"X" document of particular relevance; the claimed invention cannot be considered novel or cannot be considered to involve an inventive step when the document is taken alone
"E" earlier document but published on or after the international filing date	"Y" document of particular relevance; the claimed invention cannot be considered to involve an inventive step when the document is combined with one or more other such documents, such combination being obvious to a person skilled in the art
"L" document which may throw doubts on priority claim(s) or which is cited to establish the publication date of another citation or other special reason (as specified)	"&" document member of the same patent family
"O" document referring to an oral disclosure, use, exhibition or other means	
"P" document published prior to the international filing date but later than the priority date claimed	

Date of the actual completion of the international search  
26 November, 2003 (26.11.03)

Date of mailing of the international search report  
16 December, 2003 (16.12.03)

Name and mailing address of the ISA/  
Japanese Patent Office

Authorized officer

Facsimile No.

Telephone No.



## A. 発明の属する分野の分類 (国際特許分類 (IPC))

Int. Cl<sup>7</sup> C07C311/46, 311/48, 311/49, 311/50, 317/28, 323/49, C07D213/75, 213/42, 279/12, A01N41/06, 43/40, 47/02

## B. 調査を行った分野

調査を行った最小限資料 (国際特許分類 (IPC))

Int. Cl<sup>7</sup> C07C311/46, 311/48, 311/49, 311/50, 317/28, 323/49, C07D213/75, 213/42, 279/12, A01N41/06, 43/40, 47/02

最小限資料以外の資料で調査を行った分野に含まれるもの

国際調査で使用した電子データベース (データベースの名称、調査に使用した用語)

REGISTRY (STN), CA (STN)

## C. 関連すると認められる文献

引用文献の カテゴリー*	引用文献名 及び一部の箇所が関連するときは、その関連する箇所の表示	関連する 請求の範囲の番号
P, X	WO 03/11028 A1 (Nissan Chemical Industries, Ltd.) 2003.02.13 (ファミリーなし)	1-5
P, X	WO 02/94766 A1 (Nihon Nohyaku Co., Ltd.) 2002.11.28 & JP 2003-34672 A	1-5
X	WO 01/46124 A1 (Nihon Nohyaku Co., Ltd.) 2001.06.28 & JP 2001-240580 A & EP 1241159 A1	1-5

☐ C欄の続きにも文献が列挙されている。☐ パテントファミリーに関する別紙を参照。

## \* 引用文献のカテゴリー

「A」 特に関連のある文献ではなく、一般的技術水準を示すもの  
「E」 国際出願日前の出願または特許であるが、国際出願日以後に公表されたもの  
「L」 優先権主張に疑義を提起する文献又は他の文献の発行日若しくは他の特別な理由を確立するために引用する文献 (理由を付す)  
「O」 口頭による開示、使用、展示等に言及する文献  
「P」 国際出願日前で、かつ優先権の主張の基礎となる出願

の日の後に公表された文献

「T」 国際出願日又は優先日後に公表された文献であって出願と矛盾するものではなく、発明の原理又は理論の理解のために引用するもの  
「X」 特に関連のある文献であって、当該文献のみで発明の新規性又は進歩性がないと考えられるもの  
「Y」 特に関連のある文献であって、当該文献と他の1以上の文献との、当業者にとって自明である組合せによって進歩性がないと考えられるもの  
「&」 同一パテントファミリー文献

国際調査を完了した日

26. 11. 03

国際調査報告の発送日

16.12.03

国際調査機関の名称及びあて先

日本国特許庁 (ISA/J P)

郵便番号 100-8915

東京都千代田区霞が関三丁目4番3号

特許庁審査官 (権限のある職員)

前田 憲彦

4 H

8 3 1 8

電話番号 03-3581-1101 内線 3443